

BW

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開2000-226372

(P2000-226372A)

(43) 公開日 平成12年8月15日 (2000. 8. 15)

(51) Int. Cl. <sup>7</sup>	識別記号	F I	キーワード (参考)
C 0 7 D 213/82		C 0 7 D 213/82	4 C 0 5 5
A 0 1 N 43/40	1 0 1	A 0 1 N 43/40	1 0 1 F 4 H 0 1 1
			1 0 1 C
			1 0 1 B
			1 0 1 E

審査請求 未請求 請求項の数 4 O L (全 47 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願平11-24317	(71) 出願人	000004307 日本曹達株式会社 東京都千代田区大手町2丁目2番1号
(22) 出願日	平成11年2月1日 (1999. 2. 1)	(72) 発明者	宮原 治 神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社小田原研究所内
		(72) 発明者	小倉 美佳 神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社小田原研究所内
		(74) 代理人	100108419 弁理士 大石 治仁

最終頁に続く

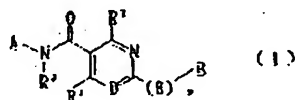
(54) 【発明の名称】 アミド化合物、その製造方法及び農薬用殺虫剤

(57) 【要約】

【課題】工業的に有利に合成でき、効果が確実で安全に使用できる有害生物防除剤。特に農薬用殺虫・殺ダニ剤となりうる新規なアミド化合物及びその製造方法を提供する。

【解決手段】一般式 (1)

【化1】



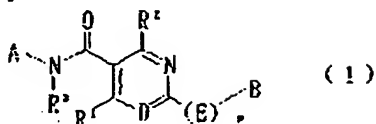
【式中、Aは、置換基Xを有していてもよい（フェニル基又はナフチル基）を表し、Bは、置換基Yを有していてもよいフェニル基を表し、X及びYは、ニトロ基、ハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>、アルキル基、C<sub>1-6</sub>、ハロアルキル基、C<sub>1-6</sub>、アルコキシ基、C<sub>1-6</sub>、ハロアルコキシ基等を表し、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、水素原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>、アルキル基、C<sub>1-6</sub>、アルコキシ基、C<sub>1-6</sub>、ハロアルキル基、C<sub>1-6</sub>、ハロアルコキシ基等を表し、R<sup>3</sup>は、水素原子、C<sub>1-6</sub>、ア

ルキル基、C<sub>1-6</sub>、アルコキシ基等を表し、Dは、N又はCHを表し、Eは、O、CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>・CH<sub>2</sub>、又はCOを表し、pは、0又は1を表す。但し、公知化合物を除く。）で表されるアミド化合物、その製造方法及び有害生物防除剤。

## 【特許請求の範囲】

【請求項1】一般式(1)

【化1】



【式中、Aは、置換基Xを有していてもよいフェニル基又は置換基Xを有していてもよいナフチル基を表し、Bは、置換基Yを有していてもよいフェニル基又は置換基Yを有していてもよいナフチル基を表す。また、前記A及びBは同一又は相異なる複数の置換基を有していてもよい。X及びYは、それぞれ独立して、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>1-6</sub>ハロアルコキシ基、C<sub>1-6</sub>シクロアルキル基、置換基を有していてもよいフェニル基、アルキルスルホニルオキシ基、C<sub>1-6</sub>アルキルカルボニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルカルボニルオキシ基、(C<sub>1-6</sub>アルキル基で置換されていてもよい)カルバモイル基、C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基又はC<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基を表し、

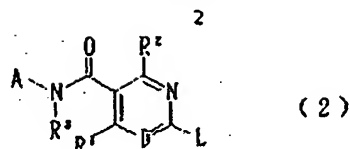
R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、それぞれ独立して、水素原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル基、C<sub>1-6</sub>ハロアルコキシ基、C<sub>1-6</sub>シクロアルキル基、置換基を有していてもよいフェニル基又は置換基を有していてもよいフェニルオキシ基を表し、R<sup>3</sup>は、水素原子、ヒドロキシ基、C<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>1-6</sub>シクロアルキル基又は置換基を有していてもよいフェニル基を表し、

Dは、N又はCHを表し、Eは、O、CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>、又はCOを表し、pは、0又は1を表す。但し、Aが2、4-ジフルオロフェニル基であり、Bが4-1-ナフチルフェニル基であり、DがNであり、EがOであり、pが1であり、かつ、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>の一方が水素原子で、もう一方がメチル基である化合物、Aがフェニル基又は4-メチルフェニル基であり、Bがフェニル基であり、DがCHであり、pが0であり、かつ、R<sup>1</sup>が水素原子であり、R<sup>2</sup>がメチル基である化合物、Aが2、6-ジエチルフェニル基であり、Bがフェニル基であり、DがCHであり、pが0であり、かつ、R<sup>1</sup>がn-プロポキシ基であり、R<sup>2</sup>がメチル基である化合物、及びR<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が同時に水素原子である化合物を除く。)で表されるアミド化合物

【請求項2】前記R<sup>1</sup>又はR<sup>2</sup>のいずれか一方がC<sub>1-6</sub>ハロアルキル基である、請求項1記載の一般式(1)で表されるアミド化合物。

【請求項3】一般式(2)

【化2】

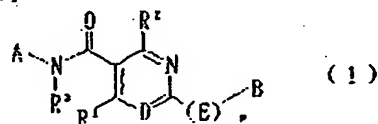


【式中、A、D、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>は前記と同じ意味を表し、Lは置換基を表す。)で表される化合物と、一般式(3)

【化3】M-(O)-B (3)

【式中、B及びpは前記と同じ意味を表し、Mは、金属又は有機金属基を表す。)で表される化合物とを反応させる工程を有する、一般式(1)

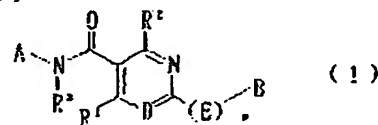
【化4】



【式中、A、B、D、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びpは、前記と同じ意味を表す。)で表される化合物の製造方法。

【請求項4】一般式(1)

【化5】



【式中、A、B、D、E、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びpは、前記と同じ意味を表す。)で表される化合物の一種若しくは二種以上を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、新規なアミド化合物、その製造方法及び該化合物を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤に関する。

【0002】

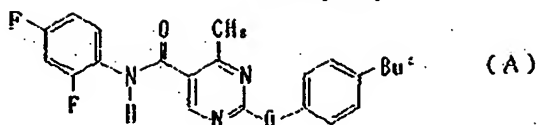
【従来の技術】農園芸作物の栽培に当り、従来より、多数の殺虫剤、殺ダニ剤が使用されている。しかしながら、その効力が不十分であったり、薬剤抵抗性問題によりその使用が制限されたり、また、植物体に薬害や汚染を生じたり、或いは入畜魚類等に対する毒性が強かったりすることから、必ずしも満足すべき防除薬剤とは言い難いものが少なくない。従って、かかる欠点の少ない安全に使用できる薬剤の開発が要望されている。

【0003】本発明化合物に類似した化合物を開示したものとしては、次のものが知られている。

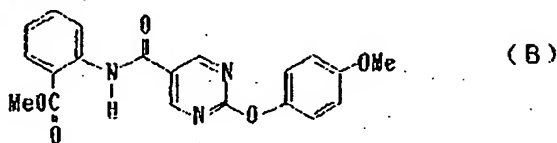
(1) EP. 569, 912号公報には、下記(A)に示される化合物が、農園芸用殺虫剤として有用である旨が記載されている。

[0004]

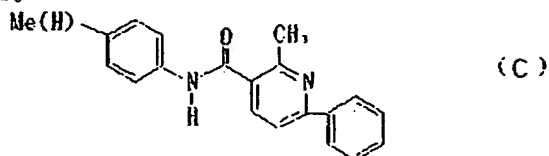
\* \* [化6]



[0005] (2) WO95/25,723号公報に ※ [0006]  
 は、下記(B)で示される化合物が 農薬用殺菌剤と [化7]  
 して有用である旨が記載されている。 ※



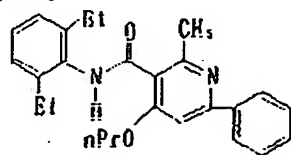
[0007] (3) Zh. Obshch. Khim., ★ [0008]  
 19 (4) 359 (1984) には、下記(C)で示さ [化8]  
 れる化合物が記載されている。 ★



[0009] (4) また、特開昭63-17813号公  
 報には、下記(D)で示される化合物が記載されてい  
 る。

[0010]

[化9]



[0011] しかしながら、本発明化合物が、農作物害  
 虫に対し殺虫活性を有することは知られていない。

[0012]

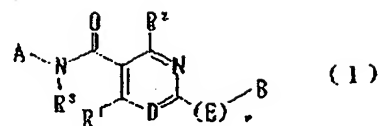
【発明が解決しようとする課題】本発明は、工業的に有  
 利に合成でき、効果が高く安全に使用できる農薬用  
 殺虫剤となりうる新規なアミド化合物、及びその製造方  
 法を提供することを目的とする。

[0013]

【課題を解決するための手段】上記課題を解決すべく、  
 本発明は、(i) 下記一般式(1)

[0014]

[化10]



39 【0015】〔式中、Aは、置換基Xを有していてもよいフェニル基又は置換基Xを有していてもよいナフチル基を表し、Bは、置換基Yを有していてもよいフェニル基又は置換基Yを有していてもよいナフチル基を表し、X及びYは、それぞれ独立して、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>1-6</sub>ハロアルコキシ基、C<sub>1-6</sub>シクロアルキル基、置換基を有していてもよいフェニル基、アルキルスルホニルオキシ基、C<sub>1-6</sub>アルキルカルボニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルカルボニルオキシ基、(C<sub>1-6</sub>アルキル基で置換されていてもよい)カルバモイル基、C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基又はC<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基を表す。また、前記A及びBは同一又は異なる複数の置換基を有していてもよい。

40 【0016】R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、それぞれ独立して、水素原子、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル基、C<sub>1-6</sub>ハロアルコキシ基、C<sub>1-6</sub>シクロアルキル基、置換基を有していてもよいフェニル基、置換基を有していてもよいフェニルオキシ基又はヒドロキシ基を表し、R<sup>3</sup>は、水素原子、ヒドロキシ基、ハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>

アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ シクロアルキル基又は置換基を有していてもよいフェニル基を表し、Dは、N又はCHを表し、Eは、O、 $CH_3$ 、 $CH_2$ 、 $CH$ 、又はCOを表し、pは、0又は1を表す。)で表されるアミド化合物を提供する。

【0017】但し、前記一般式(1)で表される化合物のうち、以下の(a)、(b)、(c)及び(d)の化合物は除かれている。

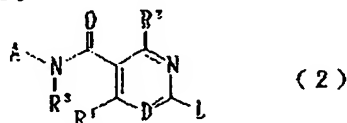
(a) Aが2、4-ジフルオロフェニル基であり、Bが4-tert-ブチルフェニル基であり、DがNであり、EがOであり、pが1であり、かつ、 $R^1$ 、 $R^2$ の一方が水素原子で、もう一方がメチル基である化合物、(b) Aがフェニル基又は4-メチルフェニル基であり、Bがフェニル基であり、DがCHであり、pが0であり、かつ、 $R^1$ が水素原子で、 $R^2$ がメチル基である化合物、(c) Aが2、6-ジエチルフェニル基であり、Bがフェニル基であり、DがCHであり、pが0であり、かつ、 $R^1$ がn-プロポキシ基で、 $R^2$ がメチル基である化合物、及び、(d)  $R^1$ 及び $R^2$ が同時に水素原子である化合物。

【0018】また、本発明においては、前記一般式(1)で表される化合物のうち、 $R^1$ 又は $R^2$ のいずれか一方が $C_{1-6}$ ハロアルキル基である化合物が、特に好ましい。

【0019】(ii) また、本発明は、一般式(2)

【0020】

【化11】



【0021】(式中、A、D、 $R^1$ 、 $R^2$ 及び $R^3$ は前記と同じ意味を表し、Lは置換基を表す)で表される化合物と、一般式(3)

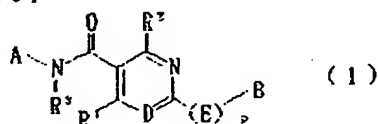
【0022】

【化12】 $M-(O)-B$  (3)

(式中、B及びpは前記と同じ意味を表し、Mは、金属又は有機金属基を表す。)で表される化合物とを反応させる工程を有する、一般式(1)

【0023】

【化13】

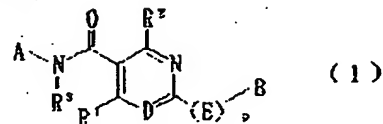


【0024】(式中、A、B、D、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 及びpは、前記と同じ意味を表す。)で表される化合物の製造方法を提供する。

【0025】(iii) さらに本発明は、一般式(1)

【0026】

【化14】



【0027】(式中、A、B、D、E、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 及びpは、前記と同じ意味を表す。)で表される化合物の一担若しくは二担以上を有効成分として含有することを特徴とする、農薬用殺虫剤を提供する。

【0028】本発明化合物は、特に農薬用作物の有害害虫に対して優れた殺虫活性を有し、本発明化合物を有効成分とする組成物は、有害生物防除剤、特に農薬用殺虫剤として有用である。

【0029】

【発明の実施の形態】以下、本発明を発明の実施の形態により詳細に説明する。本発明化合物は、前記一般式

(1)で表される化合物である。前記一般式(1)において、Aは、ベンゼン環の任意の位置に置換基Xを有していてもよいフェニル基、又はナフタレン環の任意の位置に置換基Xを有していてもよい、1-ナフチル、2-ナフチル基等のナフチル基を表す。また、Aは、同一又は相異なる複数の置換基Xを有していてもよい。

【0030】Bは、ベンゼン環の任意の位置に置換基Yを有していてもよいフェニル基、又はナフタレン環の任意の位置に置換基Yを有していてもよい、1-ナフチル、2-ナフチル基等のナフチル基を表す。また、Bは、同一又は相異なる複数の置換基Yを有していてもよい。

【0031】X及びYは、それぞれ独立して水素原子、シアノ基、ニトロ基、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン原子、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル基等の直鎖若しくは分岐の $C_{1-6}$ アルキル基、クロロメチル、ジクロロメチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロエチル、トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル基等の $C_{1-6}$ ハロアルキル基、

【0032】メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、tert-ブトキシ、sec-ブトキシ基等の $C_{1-6}$ アルコキシ基、クロロメトキシ、ジクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロエトキシ、トリフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ基等の $C_{1-6}$ ハロアルコキシ基、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル基等の $C_{3-6}$ シクロアルキル基、

【0033】ベンゼン環の任意の位置に置換基を有していてもよいフェニル基、メチルスルホニルオキシ、エチ

ルスルホニルオキシ、プロピルスルホニルオキシ基、イソプロピルスルホニルオキシ、ブチルスルホニルオキシ基等のC<sub>1</sub>、アルキルスルホニルオキシ基、アセチル、プロピオニル基等のC<sub>1</sub>、アルキルカルボニル基、アセトキシ、プロピオニルオキシ基等のC<sub>1</sub>、アルキルカルボニルオキシ基、(エチル、メチル、プロピル、イソプロピル、ブチル基等のC<sub>1</sub>、アルキル基で置換されていてもよい)カルバモイル基、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ基等のC<sub>1</sub>、アルキルチオ基、又は、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、ブチルスルホニル基等のC<sub>1</sub>、アルキルスルホニル基を表す。

【0034】ここで、前記置換基を有していてもよいフェニル基の置換基としては、フッ素、塩素、臭素等のハロゲン原子、メチル、エチル基等のC<sub>1</sub>、アルキル基、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ基等のC<sub>1</sub>、アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基等を挙げることができる。また、該フェニル基は、ベンゼン環の任意の位置に同一又は相異なる複数の置換基を有していてもよい。

【0035】R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、それぞれ独立して水素原子、シアノ基、ヒドロキシ基、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン原子、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、sec-ブチル、t-ブチル、ペンチル、ヘキシル基等の直鎖若しくは分岐のC<sub>1</sub>、アルキル基、クロロメチル、ジクロロメチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロエチル、トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル基等のC<sub>1</sub>、ハロアルキル基、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、t-ブトキシ、sec-ブトキシ基等のC<sub>1</sub>、アルコキシ基、クロロメトキシ、ジクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロエトキシ、トリフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ基等のC<sub>1</sub>、ハロアルコキシ基、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル基等のC<sub>1</sub>、シクロアルキル基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は、置換基を有していてもよいフェニルオキシ基を表す。

【0036】ここで、前記置換基を有していてもよいフェニル基又は置換基を有していてもよいフェニルオキシ基の置換基としては、フッ素、塩素、臭素等のハロゲン原子、メチル、エチル基等のC<sub>1</sub>、アルキル基、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ基等のC<sub>1</sub>、アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基等を挙げることができる。また、該フェニル基又はフェニルオキシ基は、ベンゼン環の任意の位置に同一又は相異なる複数の置換基を有していてもよい。

【0037】この場合において、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>のどちらか一方は、C<sub>1</sub>、ハロアルキル基であるのが好ましく、

より好ましくは、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>のどちらか一方は、C<sub>1</sub>、ハロアルキル基であり、もう一方は、水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>、アルキル基、C<sub>1</sub>、ハロアルキル基、C<sub>1</sub>、アルコキシ基、C<sub>1</sub>、ハロアルコキシ基、C<sub>1</sub>、シクロアルキル基、置換基を有していてもよいフェニル基、シアノ基、ニトロ基又はヒドロキシ基である。

【0038】R<sup>3</sup>は、水素原子、シアノ基、ヒドロキシ基、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、sec-ブチル、t-ブチル、ペンチル、ヘキシル基等の直鎖若しくは分岐のC<sub>1</sub>、アルキル基、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、t-ブトキシ、sec-ブトキシ基等のC<sub>1</sub>、アルコキシ基、クロロメトキシ、ジクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロエトキシ、トリフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ基等のC<sub>1</sub>、ハロアルコキシ基、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル基等のC<sub>1</sub>、シクロアルキル基、又は、置換基を有していてもよいフェニル基を表す。

【0039】ここで、前記置換基を有していてもよいフェニル基の置換基としては、フッ素、塩素、臭素等のハロゲン原子、メチル、エチル基等のC<sub>1</sub>、アルキル基、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ基等のC<sub>1</sub>、アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基等を挙げることができる。また、該フェニル基は、ベンゼン環の任意の位置に同一又は相異なる複数の置換基を有していてもよい。

【0040】Dは、N又はCHを表し、Eは、O、CH、CH<sub>2</sub>、又はCOを表し、pは、0又は1を表す。

【0041】前記一般式(1)で表される化合物のうち、Aが2、4-ジフルオロフェニル基(上位概念的には、2、4位にハロゲン原子を有するフェニル基)であり、Bが4-t-ブチルフェニル基(上位概念的には、4位にC<sub>1</sub>、アルキル基を有するフェニル基)であり、DがNであり、EがOであり、pが1であり、かつ、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>の一方が水素原子で、もう一方がメチル基である前記一般式(1)で表される化合物。

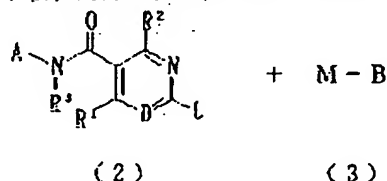
【0042】Aがフェニル基又は4-メチルフェニル基(上位概念的には、フェニル基又は4位にC<sub>1</sub>、アルキル基を有するフェニル基)であり、Bがフェニル基であり、DがCHであり、pが0であり、かつ、R<sup>1</sup>が水素原子であり、R<sup>2</sup>がメチル基である化合物。

【0043】Aが2、6-ジエチルフェニル基(上位概念的には、2、6位にC<sub>1</sub>、アルキル基を有するフェニル基)であり、Bがフェニル基であり、DがCHであり、pが0であり、かつ、R<sup>1</sup>がn-プロポキシ基であり、R<sup>2</sup>がメチル基である化合物、及び、

【0044】R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が同時に水素原子である化合物は公知化合物である。従って、本発明においてはこれらの化合物は除かれている。

【0045】本発明化合物は以下の方法により製造することができる。

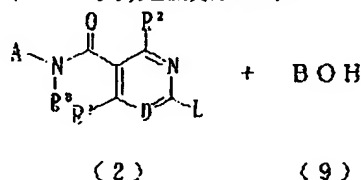
(製造法1) 前記一般式(1)において、pが0の化合物(1-1)は、以下のようにして製造することができる\*



【0047】【式中、A、B、D、p、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及びは前記と同じ意味を表し、しは、塩素、臭素、メシル基、トシル基等の脱離基を表し、Mは、ナトリウム、カリウム、リチウム等のアルカリ金属、マグネシウム、カルシウム等のアルカリ土類金属、Cu、Ni等の遷移金属、SnBu<sub>3</sub>、B(OH)<sub>3</sub>等の有機金属基、MgBr、MgI等を表す。】

【0048】この方法は、一般式(2)で表される化合物と一般式(3)で表される化合物とを、不活性溶媒中、触媒の存在下、反応温度-50℃~200℃、好ましくは0℃~150℃で、1~96時間反応させることにより、一般式(1-1)で表される化合物を製造するものである。

【0049】この反応に用いることができる溶媒としては、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジエチル



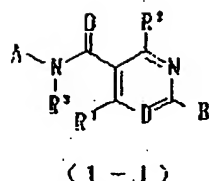
【0053】【式中、A、B、D、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>は前記と同じ意味を表す。】

【0054】この方法は、一般式(2)で表される化合物と、一般式(9)で表される化合物とを、不活性溶媒中、塩基の存在下、反応温度-50℃~200℃、好ましくは0℃~150℃で、1~96時間反応させることにより、一般式(1-2)で表される化合物を製造するものである。

【0055】この反応に用いることができる溶媒としては、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン(THF)、ジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、N、N-ジメチルホルムアミド(DMF)、ジメチルスルホキシド(DMSO)等が挙げられ、好ましくは、DMF、THF、ジ

＊る。

【0046】  
【化15】

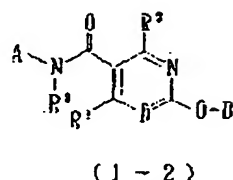


※ルエーテル、テトラヒドロフラン(THF)、ジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、N、N-ジメチルホルムアミド(DMF)、ジメチルスルホキシド(DMSO)等が挙げられ、好ましくは、THF、ジオキサン、アセトニトリルを例示することができる。

【0050】また、この反応に用いることができる触媒としては、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリド、ニッケル(II)アセチルアセトナート等が挙げられる。

【0051】(製造法2) 前記一般式(1)において、Eが酸素原子の化合物(1-2)は、次のようにして製造することができる。

【0052】  
【化16】

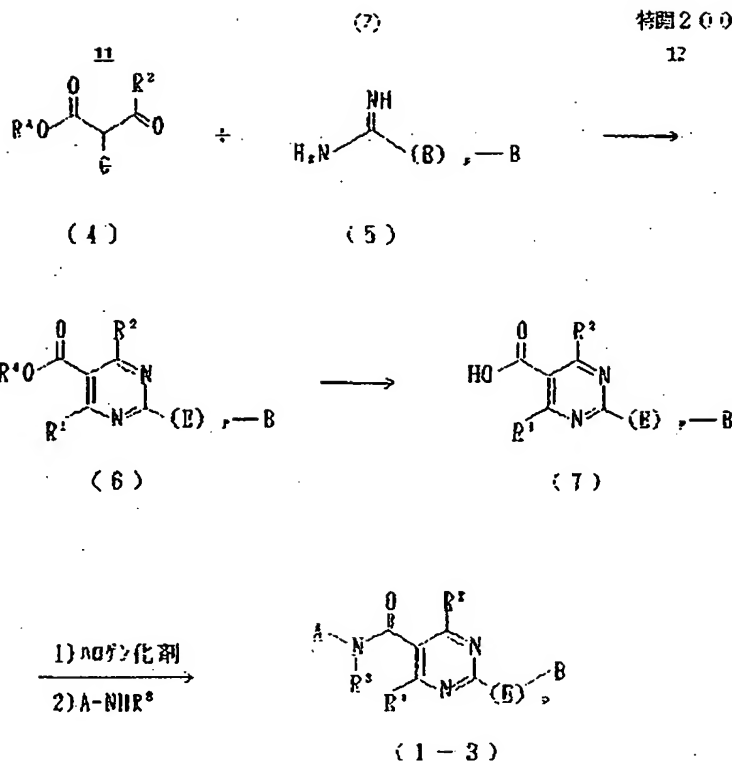


オキサン、アセトニトリルを例示することができる。

【0056】また、反応に用いることのできる塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の無機塩基や、トリエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン(DBU)等のアミン類、酸化銀(Ag<sub>2</sub>O)及び炭酸銀等の金属塩等が挙げられる。

【0057】(製造法3) また、前記一般式(1)で表される化合物のうち、Dが窒素原子である化合物(1-3)は、次のような方法によっても製造することができる。

【0058】  
【化17】



【0059】〔式中、A、B、E、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びpは前記と同じ意味を表し（但し、R<sup>3</sup>がハロゲン原子の場合を除く。）、R<sup>1</sup>は、低級アルキル基を表し、Gは、COR<sup>1</sup>又はC(R<sup>1</sup>)OR<sup>1</sup>を表し、R<sup>2</sup>は、C<sub>1-6</sub>アルキル基を表す。〕

【0060】この方法は次の工程からなる。まず、一般式(4)で表される化合物と一般式(5)で表される化合物とを、不活性溶媒中、塩基の存在下、反応温度-50℃～200℃、好ましくは0℃～150℃で、1～96時間反応させることにより、一般式(6)で表される中間体を得る。

【0061】この反応に用いることができる溶媒としては、メタノール、エタノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン（THF）、ジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、N、N-ジメチルホルムアミド（DMF）、ジメチルスルホキシド（DMSO）等が挙げられ、好ましくは、メタノールやエタノールを例示することができる。

【0062】また、反応に用いることのできる塩基としては、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等の金属アルコラート類、水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基や、トリエチルアミン、DBU等のアミン類、酸化銀（Ag<sub>2</sub>O）、炭酸銀等の金属類等が挙げられ、好ましくは、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等が挙げられる。

【0063】次いで、得られた中間体のエステルを適宜

の加水分解反応により一般式(7)のカルボン酸とし、更に対応するカルボン酸ハライドとした後、A-NHR<sup>3</sup>で表される化合物と反応させることにより、一般式(1-3)で表される化合物を得ることができる。

【0064】一般式(7)のカルボン酸から対応するカルボン酸ハライドを合成する反応においては、塩化チオニル、塩化スルフリル等のハロゲン化剤を用いることができる。ハロゲン化剤は、カルボン酸1当量に対し、1当量から大過剰量を使用することができる。

【0065】更に、前記一般式A-NHR<sup>3</sup>で表される化合物との反応においては、所望により炭酸カリウム、トリエチルアミン等の塩基を存在させてもよい。

【0066】これらの反応において用いることのできる溶媒としては、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、クロロホルム、塩化メチレン等のハロゲン化炭素類が挙げられる。

【0067】（製造法4）また、前記一般式(7)のカルボン酸と、前記一般式A-NHR<sup>3</sup>で表される化合物とを脱水縮合剤の存在下、直接に反応させることにより、一般式(1-3)で表される化合物を製造することもできる。

【0068】この反応で用いることのできる脱水縮合剤としては、ジシクロヘキシルカルボジイミド（DCC）や、ジフェニルジスルフィドとn-ブチルホスフィン、アゾジカルボン酸ジエチルとトリフェニルホスフィン等が挙げられる。

【0069】また、この脱水縮合反応に用いられる溶媒

としては、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、クロロホルム、塩化メチレン等のハロゲン化炭素類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン（THF）、ジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、N、N-ジメチルホルムアミド（DMF）、ジメチルスルホキシド（DMSO）等が挙げられる。

【0070】いずれの反応を行った場合も、反応終了後は通常の後処理を行うことにより、目的物を得ることができる。本発明化合物の構造は、IR、NMR、Massスペクトルなどから決定することができる。

【0071】（殺虫・殺ダニ剤）このようにして得られる本発明化合物を実際に施用する際には、他成分を加えず純粋な形で使用できるし、また農薬として使用する目的で一般の農薬のとり得る形態、すなわち、粒剤、粉剤等の固型製剤、水和剤、乳剤、水溶液、懸濁剤、フロアブル等の液体製剤の形態で使用することもできる。

【0072】固型製剤を目的とする場合には、添加剤及び担体として、大豆粒、小麦粉等の植物性粉末、珪藻土、煅灰石、石こう、タルク、ベントナイト、パイロフィライト、クレイ等の鉱物性微粉末、安息香酸ソーダ、尿素、芒硝等の有機及び無機化合物を用いることができる。

【0073】また、液体製剤を目的とする場合には、ケロシン、キシレン及びソルベントナフサ等の石油留分、シクロヘキサン、シクロヘキサノン、DMF、DMSO、アルコール、アセトン、トリクロロエチレン、メチルイソブチルケトン、鉱物油、植物油、水等を溶剤として用いることができる。

【0074】さらに、これらの製剤において均一かつ安定な形態をとるために、必要に応じ界面活性剤を添加することもできる。界面活性剤としては、特に限定はないが、例えば、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンが付加したアルキルエーテル、ポリオキシエチレンが付加した高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したソルビタン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したトリステリルフェニルエーテル等の非イオン性界面活性剤、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテルの硫酸エステル塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、高級アルコールの硫酸エステル塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ポリカルボン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩のホルムアルデヒド縮合物、イソブチレン-無水マレイン酸の共重合体等が挙げられる。

【0075】これらの製剤中の有効成分（化合物

（1））の含有量は、好ましくは0.01～90重量％、より好ましくは0.05～85重量％である。

【0076】このようにして得られる水和剤、乳剤、懸濁剤、フロアブル剤等の液体製剤は水で所定の濃度に希

釈して懸濁液あるいは乳濁液として、粉剤、粒剤等の固型製剤はそのまま植物に散布する方法で施用することができる。

【0077】（殺虫・殺ダニ剤）本発明化合物は、農薬上の有害生物、寄生害虫、貯蔵害虫、衣類害虫、家庭害虫等の防除に使用でき、殺成虫、殺若虫、殺幼虫、殺卵作用を有する。その代表例として、下記のものが挙げられる。

【0078】鱗翅目害虫、例えば、ハスモンヨトウ、ヨトウガ、タマナヤガ、アオムシ、タマナギンウバ、コナガ、チャノコカクモンハマキ、チャハマキ、モモシンクイガ、ナシヒメシンクイ、ミカンハモグリガ、チャノホソガ、キンモンホソガ、マイマイガ、チャドクガ、ニカメイガ、コブノメイガ、ヨーロッパアンカーボーラー、アメリカシロヒトリ、スジマダラメイガ、ヘリオティス属、ヘリコベルパ属、アグロティス属、イガ、コドリリング、ワタアカミムシ等。半翅目害虫、例えば、モモアカアブラムシ、ワタアブラムシ、ニセダイコンアブラムシ、ムギクビレアブラムシ、ホソヘリカメムシ、アオクサカメムシ、ヤノネカイガラムシ、クワコナカイガラムシ、オンシツコナジラミ、タバココナジラミ、ナシキジラミ、ナシゲンバイムシ、トビイロウンカ、ヒメトビウンカ、セジロウンカ、ツマグロヨコバイ等。

【0079】鞘翅目害虫、例えば、キスジノミムシ、ウリハムシ、コロラドハムシ、イネミズゾウムシ、コクゾウムシ、アズキゾウムシ、マメコガネ、ヒメコガネ、ジアプロティカ属、タバコシバンムシ、ヒラタキケムシ、マツノマダラカミキリ、ゴマダラカミキリ、アグリオティス属、ニジュウヤホシテントウ、コクヌスト、ワタミゾウムシ等。

【0080】双翅目害虫、例えば、イエバエ、オオクロバエ、センチコバエ、ウリミバエ、ミカンコミバエ、タネバエ、イネハモグリバエ、キイロショウジョウバエ、サシバエ、コガタアカイエカ、ネッタイシマカ、シナハマダラカ等。総翅目害虫、例えば、ミナミキイロアザミウマ、チャノキイロアザミウマ等。膜翅目害虫、例えば、イエヒメアリ、キイロスズメバチ、カブラハバチ等。直翅目害虫、例えば、トノサマバッタ等。綱翅目害虫、例えば、チャバネゴキブリ、ワモンゴキブリ、クロゴキブリ等。等翅目害虫、例えば、イエシロアリ、ヤマトシロアリ等。隠翅目害虫、例えば、ヒトノミ等。シラミ目害虫、例えば、ヒトジラミ等。ダニ類、例えば、ナミハダニ、カンザワハダニ、ミカンハダニ、リンゴハダニ、ミカンサビダニ、リンゴサビダニ、チャノホコリダニ、ブレババルバス属、エオテトラニカス属、ロビンネダニ、ケナガコナダニ、コナヒョウヒダニ、オウシマダニ、フタトゲチマダニ等。植物寄生性線虫類、例えば、ザツマイモネコブセンチュウ、ネグサレセンチュウ、ダイズシストセンチュウ、イネシナガレセンチュウ、マツノザイセンチュウ等。



【0081】また、近年、コナガ、ウンカ、ヨコバイ、アブラムシ等多くの害虫やハダニ類において有機リン剤、カーバメート剤や殺ダニ剤に対する抵抗性が発達し、それら薬剤の効力不足問題を生じており、抵抗性系統の害虫やダニにも有効な薬剤が望まれている。本発明化合物は感受性系統のみならず、有機リン剤、カーバメート剤又はピレスロイド剤抵抗性系統の害虫や殺ダニ剤抵抗性系統のダニにも優れた殺虫殺ダニ効果を有する薬剤である。また、本発明化合物は薬害が少なく、魚害、温血動物への毒性が低く、安全性の高い薬剤である。

【0082】また、本発明化合物は、水棲生物が底底、魚網等の水中接触物に付着するのを防止するための防汚剤として使用することもできる。さらに、本発明化合物を塗料や繊維等に混入させることで、壁や浴槽、あるいは靴や衣服の防菌、防臭剤として使用することもできる。

【0083】本発明化合物を農園芸用殺菌剤、殺虫剤又は殺ダニ剤として用いる場合、単独でも十分な効力を発揮するが、各種の殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤又は共力剤の1種類以上と混合して使用することもできる。

【0084】本発明化合物と混合して使用できる、殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、植物成長調整剤としては、以下のようなものが挙げられる。

【0085】殺菌剤：キャブタン、フォルベット、チウラム、ジラム、ジネブ、マンネブ、マンコゼブ、プロピネブ、ポリカーバメート、クロロタロニル、キントーゼン、キャブタホル、イプロジオン、プロサイミドン、ピンクロゾリン、フルオロイミド、サイモキサニル、メブロンニル、フルトラニル、ベンシクロン、オキシカルボキシシン、ホセチルアルミニウム、プロバモカーブ、トリアジメホン、トリアジメノール、プロピコナゾール、ジクロプロトラゾール、ピタルタノール、ヘキサコナゾール、マイクロブタニル、フルシラゾール、エタコナゾール、フルオトリマゾール、フルトリアフェン、ベンコナゾール、ジニコナゾール、サイプロコナゾール、フェナリモール、トリフルミゾール、プロクロラズ、イマザリル、ペフラゾエート、トリデモルフ、フェンプロピモルフ、トリホリン、ブチオベート、ピリフェノックス、アニラジン、ポリオキシシン、メタラキシル、オキサジキシル、フララキシル、イソプロチオラン、プロベナゾール、ピロールニトリン、プラストサイジンS、カスガマイシン、バリダマイシン、硫酸ジヒドロストレプトマイシン、ベノミル、カルベンダジム、チオファネートメチル、ヒメキサゾール、塩基性塩化銅、塩基性硫酸銅、フェンチンアセテート、水酸化トリフェニル錫、ジエトフェンカルブ、メタスルホカルブ、キノメチオネート、ピナバクリル、レンチン、重曹、ジチアノン、ジノカッブ、フェナミノスルフ、ジクロメジン、グアザチン、ドジン、IBP、エディフェンホス、メバニピリム、フェルムゾン、トリクラミド、メタスルホカルブ、フルアジ

ナム、エトキノラック、ジメトモルフ、ピロキロン、テクロフタラム、フサライド、フェナジンオキシド、チアベンダゾール、トリシクラゾール、ピンクロゾリン、シモキサニル、シクロブタニル、グアザチン、プロバモカルブ塩酸塩、オキシリニック酸、フェナモリル、シプロコナゾール、エボキシコナゾール、メトコナゾール、ヒドロキシイソオキサゾール、イミノクタジン酢酸塩等。

【0086】殺虫・殺ダニ剤：

有機燐及びカーバメート系殺虫剤：フェンチオン、フェニトロチオン、ダイアジノン、クロルピリホス、ES-P、バミドチオン、フェントエート、ジメトエート、ホルモチオン、マラソン、トリクロロホン、チオメトン、ホスメット、ジクロロホス、アセフェート、EPBP、メチルパラチオン、オキシジメトンメチル、エチオン、サリチオン、シアノホス、イソキサチオン、ピリダフェンチオン、ホサロン、メチダチオン、スルプロホス、クロルフェンビンホス、テトラクロロビンホス、ジメチルビンホス、プロバホス、イソフェンホス、エチルチオメトン、プロフェノホス、ピラクロホス、モノクロトホス、アジンホスメチル、アルディカルブ、メソミル、チオジカルブ、カルボフラン、カルボスルファン、ベンフラカルブ、フラチオカルブ、プロボキスル、BPMC、MTMC、MIPC、カルバリル、ビリミカーブ、エチオフェンカルブ、フェノキシカルブ、EDDP等。

【0087】ピレスロイド系殺虫剤：ベルメトリン、シベルメトリン、デルタメスリン、フェンバレーレート、フェンプロバトリン、ピレトリン、アレシリン、テトラメスリン、レスメトリン、ジメスリン、プロバスリン、フェノトリン、プロトリン、フルバリネート、シフルトリン、シハロトリン、フルシトリネート、エトフェンプロクス、シクロプロトリン、トロラメトリン、シラフルオフェン、プロフェンプロクス、アクリナトリン等。

【0088】ベンゾイルウレア系その他の殺虫剤：ジフルベンズロン、クロルフルアズロン、ヘキサフルムロン、トリフルムロン、テトラベンズロン、フルフェノクスロン、フルシクロクスロン、プロプロフェジン、ピリプロキシフェン、メトブレン、ベンゾエピン、ジアフェンチウロン、アセタミプリド、イミダクロプリド、ニテンピラム、フィプロニル、カルタップ、チオシクラム、ペンシルタップ、硫酸ニコチン、ロテノン、メタアルデヒド、有機油、BTや昆虫病原ウイルス等の微生物農薬等。

【0089】殺線虫剤：フェナミホス、ホスチアゼート等。

【0090】殺ダニ剤：クロルベンジレート、フェニソプロモレート、ジコホル、アミトラズ、BPPS、ベンゾメート、ヘキシチアゾクス、酸化フェンブタズ、ポリナクチン、キノメチオネート、CPCBS、テトラジホン、アベルメクチン、ミルベメクチン、クロフェンテジン、シヘキサチン、ピリダベン、フェンピロキシメー

ト、テブフェンピラド、ピリミジフェン、フェノチオカルブ、ジエノクロル、エトキサゾール、ハルフェンブックス等。

【0091】植物生長調節剤：ジベレリン類（例えばジベレリンA<sub>2</sub>、ジベレリンA<sub>1</sub>、ジベレリンA<sub>3</sub>）、IAA、NAA等。

【0092】

【実施例】次に実施例を挙げて本発明化合物を更に詳細\*

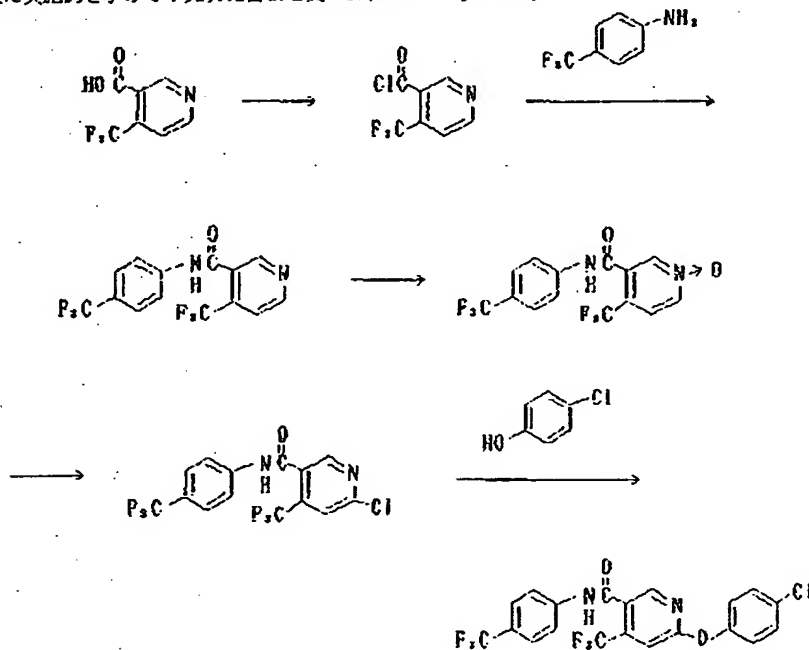
\*に説明する。

実施例1

6-(4-クロロフェニルオキシ)-4-トリフルオロメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ピリジンカルボキシアミド（化合物番号1-60）の製造

【0093】

【化18】



【0094】4-トリフルオロメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ピリジンカルボン酸2.13gをベンゼン30mlに溶解し、塩化チオニル3.98gを加えて3時間加熱還流した。反応液を冷却後、減圧濃縮し、残留物をジオキサラン20mlに溶解し、トリエチルアミン1.4g及び4-トリフルオロメチルアニリン2.25gを加え、室温で4時間攪拌した。反応液を減圧濃縮した後、得られた粗結晶をヘキサンで洗浄し、4-トリフルオロメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ピリジンカルボキシアミドを3.3g（収率89%）得た。

【0095】次に、得られた4-トリフルオロメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ピリジンカルボキシアミド3.3gをクロロホルム50mlに溶解し、m-クロロ過安息香酸3.65gを加えて、室温で一昼夜攪拌した。反応液を飽和重曹水溶液で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮して、4-トリフルオロメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-〔N-(4-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル〕-ピリジン-1-オキシドを1.7g（収率50%）得た。

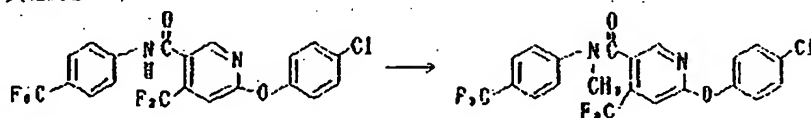
【0096】得られた4-トリフルオロメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-〔N-(4-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル〕-ピリジン-1-オキシド1.7gをベンゼン30mlに溶解し、塩化チオニル3.98gを加えて3時間加熱還流した。反応液を冷却後、減圧濃縮し、残留物をジオキサラン20mlに溶解し、トリエチルアミン1.4g及び4-トリフルオロメチルアニリン2.25gを加え、室温で4時間攪拌した。反応液を減圧濃縮した後、得られた粗結晶をヘキサンで洗浄し、4-トリフルオロメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ピリジンカルボキシアミドを3.3g（収率89%）得た。

〔N-(4-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル〕-ピリジン-1-オキシド1.7gをベンゼン30mlに溶解し、塩化チオニル3.98gを加えて3時間加熱還流した。冷却後、反応液を減圧濃縮し、酢酸エチルと飽和重曹水溶液を加えて分液し、有機層を分取した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮した。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=10：1）で精製し、6-クロロ-4-トリフルオロメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ピリジンカルボキシアミドを0.55g（収率31%）得た。

【0097】次に、4-クロロフェノール0.1gをDMF3mlに溶解し、水素化ナトリウムを0.07g加え、反応系内から気体の発生がなくなるまで室温で攪拌した。さらに、6-クロロ-4-トリフルオロメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ピリジンカルボキシアミド0.27gをDMF5mlに溶解した液を加え、90℃で3日間攪拌した。冷却後、反応混合物を水の中に加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。得られ

た粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝10：1）で精製し、目的物である6-（4-クロロフェニルオキシ）-4-トリフルオロメチル-N-（4-トリフルオロメチルフェニル）-3-ピリジンカルボキシアミドを0.15g（収率44%）得た。mp. 162-164℃

【0098】実施例2



【0100】実施例1で得た6-（4-クロロフェニルオキシ）-4-トリフルオロメチル-N-（4-トリフルオロメチルフェニル）-3-ピリジンカルボキシアミド0.1gをDMF 3mlに溶解し、ヨウ化メチル0.05g及び炭酸カリウム0.05gを加え、室温で一昼夜撹拌した。反応混合物を水の中に加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮した。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝10：1）で精製し、目的物である6-（4-クロロフェニル

\*6-（4-クロロフェニルオキシ）-4-トリフルオロメチル-N-メチル-N-（4-トリフルオロメチルフェニル）-3-ピリジンカルボキシアミド（化合物番号1-62）の製造

【0099】

【化19】

※（4-トリフルオロメチルフェニル）-3-ピリジンカルボキシアミドを70mg（収率67%）得た。

mp. 126-128℃

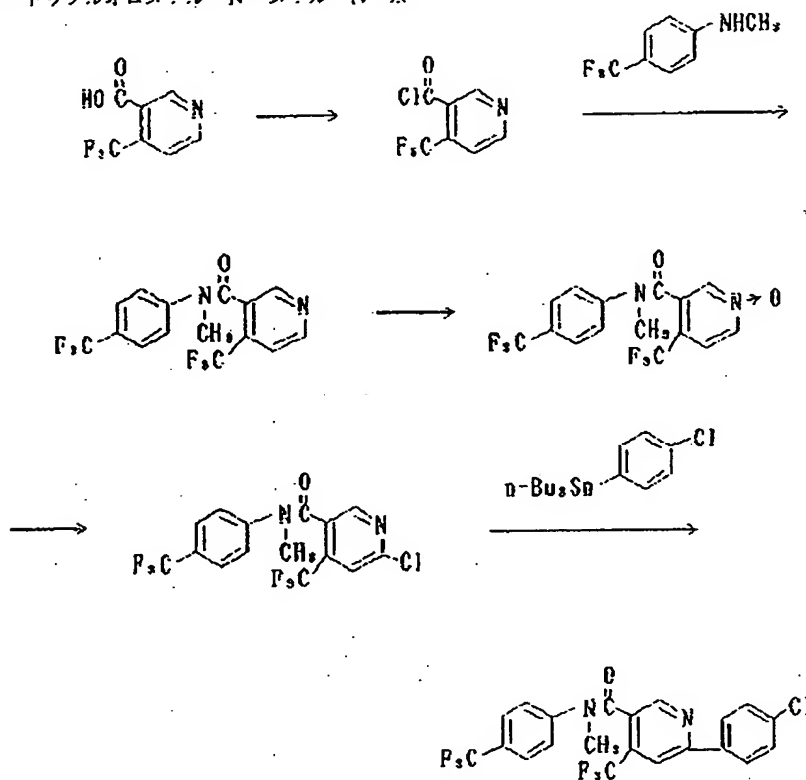
【0101】実施例3

6-（4-クロロフェニル）-4-トリフルオロメチル-N-メチル-N-（3,4-ジクロロフェニル）-3-ピリジンカルボキシアミド（化合物番号1-83）の製造

29 製造

【0102】

【化20】



【0103】4-トリフルオロメチル-3-ピリジンカルボン酸2.0gをベンゼン30mlに溶解し、塩化チ

オニル3.74g及びピリジン一滴を加えて、1時間加熱還流した。反応液を冷却し、減圧濃縮した後、残留物をジオキサン20mlに溶解し、トリエチルアミン1.32g及び3,4-ジクロロ-N-メチルアニリン2.3gを加え、室温で4時間攪拌した。反応混合物を減圧濃縮した後、得られた粗結晶をヘキサンで洗浄し、4-トリフルオロメチル-N-メチル-N-(3,4-ジクロロフェニル)-3-ピリジンカルボキシアミドを2.9g(収率79%)得た。

【0104】得られた4-トリフルオロメチル-N-メチル-N-(3,4-ジクロロフェニル)-3-ピリジンカルボキシアミド2.9gをクロロホルム50mlに溶解し、m-クロロ過安息香酸6.16gを加えて室温で一昼夜攪拌した。反応液を飽和重炭酸水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、4-トリフルオロメチル-3-[N-メチル-N-(3,4-ジクロロフェニル)カルバモイル]ピリジン-1-オキシドを3g(収率99%)得た。

【0105】得られた4-トリフルオロメチル-3-[N-メチル-N-(3,4-ジクロロフェニル)カルバモイル]-ピリジン-1-オキシド3gをオキシ塩化リン20ml中で1時間加熱還流した。冷却後、減圧濃縮し、酢酸エチルと飽和重炭酸水溶液を加え、洗浄し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、6-クロロ-4-トリフルオロメチル-N-メチル-N-

(3,4-ジクロロフェニル)-3-ピリジンカルボキシアミドを1.36g(収率43%)得た。

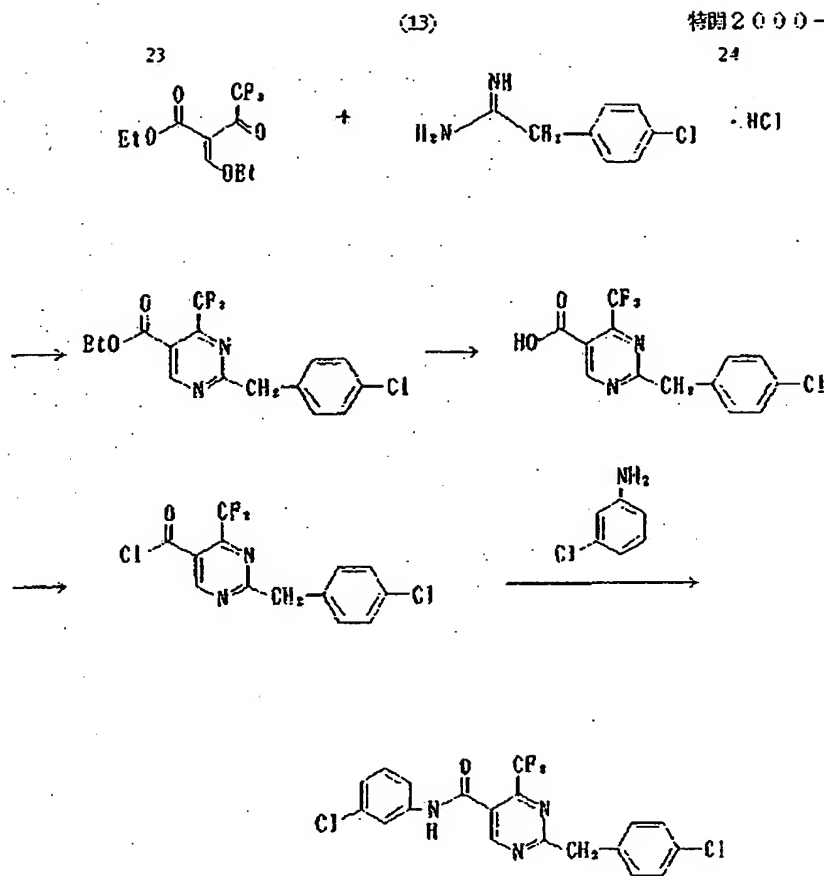
【0106】得られた6-クロロ-4-トリフルオロメチル-N-メチル-N-(3,4-ジクロロフェニル)-3-ピリジンカルボキシアミドをジオキサン10mlに溶解し、窒素気流中で、トリ-n-ブチル-(4-クロロフェニル)スズ0.63g、及びテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)0.17gを加えて2日間加熱還流した。反応液を冷却した後、減圧濃縮し、酢酸エチルを加えて、飽和重炭酸水溶液で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮した。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=10:1)で精製し、目的物である6-(4-クロロフェニル)-4-トリフルオロメチル-N-メチル-N-(3,4-ジクロロフェニル)-3-ピリジンカルボキシアミドを0.26g(収率40%)得た。このものの<sup>1</sup>H-NMRデータ(NMR-3)を第4表に示す。

【0107】実施例4

2-(4-クロロベンジル)-4-トリフルオロメチル-N-(3-クロロフェニル)-5-ピリジンカルボキシアミド(化合物番号I-56)の製造

【0108】

【化21】



【0109】4-クロロフェニルアセトアミジン塩酸塩 2.05 g をエタノール 20 ml に溶解し、ナトリウムエトキシド 1.36 g を加えた後、さらに、エチル 2-エトキシメチレン-3-オキソ-4,4,4-トリフルオロプロピレート 2.58 g のエタノール 5 ml 溶液を加え、室温で一昼夜攪拌した。反応混合物を氷水中に加え、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮した。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 10 : 1）で精製し、エチル 2-(4-クロロベンジル)-4-トリフルオロメチル-5-ピリミジンカルボキシレートを 1.2 g（収率 35%）得た。

【0110】得られたエチル 2-(4-クロロベンジル)-4-トリフルオロメチル-5-ピリミジンカルボキシレート 1 g をメタノール 8 ml に溶解し、1 N-水酸化ナトリウム水溶液を 8 ml 加え、室温で一昼夜攪拌した。反応混合物を氷水中に加え、1 N-塩酸 8.5 ml を加えて酸性とし、析出結晶をろ取することにより、2-(4-クロロベンジル)-4-トリフルオロメチル

-5-ピリミジンカルボン酸を 0.87 g（収率 78%）得た。

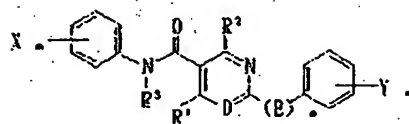
【0111】得られた 2-(4-クロロベンジル)-4-トリフルオロメチル-5-ピリミジンカルボン酸 0.4 g 及び 3-クロロアニリン 0.19 g を酢酸エチル 5 ml に溶解した後、ジシクロヘキシルカルボジイミド 0.26 g の酢酸エチル 5 ml 溶液を滴下し、室温で 4 時間攪拌した。反応混合物中から析出物をろ別した後、反応液を 1 N-塩酸で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮した。得られた粗結晶をジエチルエーテルで洗浄し、目的物である 2-(4-クロロベンジル)-4-トリフルオロメチル-N-(3-クロロフェニル)-5-ピリミジンカルボキシアミドを 0.2 g（収率 37%）得た。mp. 151-153℃

【0112】以上の様にして得られる本発明化合物の代表例を第 1 表～第 3 表に示す。また、化合物の <sup>1</sup>H-NMR データを第 4 表にまとめた。

【0113】

【表 101】

第 1 表



化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(B)	D	X <sub>m</sub>	Y <sub>n</sub>	物性値 mp. °C
1-1	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-Cl	2-Br	[194-196]
1-2	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-Cl	H	[188-199]
1-3	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-Cl	2-Cl	[191-192]
1-4	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-CF <sub>3</sub>	2-Cl	[181-182]
1-5	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-OCF <sub>3</sub>	2-Cl	[186-189]
1-6	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-Cl	2-CN	[168-170]
1-7	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-Cl	2-NO <sub>2</sub>	[184-186]
1-8	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-Cl	4-Cl	[196-198]
1-9	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-CF <sub>3</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>	[192-194]
1-10	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-Cl	4-Br	[213-215]
1-11	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-Cl	2-Me	[188-191]
1-12	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-CF <sub>3</sub>	2-Br	[185-187]
1-13	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-CF <sub>3</sub>	3-Br	[102-104]
1-14	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-CF <sub>3</sub>	3-Me	[189-192]
1-15	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-CF <sub>3</sub>	H	[201-203]
1-16	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-CF <sub>3</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub>	[211-212]
1-17	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-CF <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>	[204-207]

[0114]

[表102]

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(E),	D	X <sub>a</sub>	Y <sub>a</sub>	物性値 mp. °C
1-18	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	4-CF <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>	[175-178]
1-19	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	4-CF <sub>3</sub>	3-Cl	[185-187]
1-20	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	3-Cl	4-Cl	[161-162]
1-21	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	4-Cl	2-i	[200-201]
1-22	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	4-Ph	4-Cl	[233-235]
1-23	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-CF <sub>3</sub>	4-Cl	[198-200]
1-24	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-OCF <sub>3</sub>	H	[180-182]
1-25	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-OCF <sub>3</sub>	2-CN	[161-163]
1-26	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	3-CF <sub>3</sub>	2-Cl	[134-137]
1-27	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	3-CF <sub>3</sub>	4-Cl	[122-125]
1-28	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	3-Cl	4-Br	[155-157]
1-29	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	3-Cl	4-F-3-CF <sub>3</sub>	[185-187]
1-30	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-P-3-CF <sub>3</sub>	4-Br	[163-165]
1-31	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	2,4-F <sub>2</sub>	4-Br	[165-167]
1-32	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	2,6-Cl <sub>2</sub>	4-Br	[234-236]
1-33	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	3-Cl	H	[143-145]
1-34	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-CF <sub>3</sub>	4-Ph	[213-214]
1-35	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	5-Cl-2-OMs	H	[126-128]
1-36	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	5-Cl-2-OM	H	[201-203]
1-37	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	3,4-Cl <sub>2</sub>	4-Cl	[161-163]

\* OMs:OSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

[0115]

[表103]

第 1 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(B),	D	I <sub>1</sub>	I <sub>2</sub>	物性値 mp, °C
1-38	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	H	4-Cl	4-Cl	[103-105]
1-39	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	H	4-Cl	2-Cl	[112-114]
1-40	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	H	4-Cl	4-Br	[137-140]
1-41	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	H	4-CF <sub>3</sub>	4-Br	[142-144]
1-42	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	H	3-Cl	4-Cl	NMR-1
1-43	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	4-Cl	[ 88-90 ]
1-44	CF <sub>3</sub>	H	OH	O	H	4-Cl	4-Cl	[198-200]
1-45	CF <sub>3</sub>	H	OH	O	H	4-Cl	4-Br	[188-189]
1-46	CH <sub>3</sub>	H	H	O	H	4-CF <sub>3</sub>	2-Cl	[163-166]
1-47	CH <sub>3</sub>	H	H	O	H	4-CF <sub>3</sub>	2-CN	[162-164]
1-48	CF <sub>3</sub> H	H	H	O	H	3-Cl	4-Br	[112-114]
1-49	CF <sub>3</sub> H	H	H	O	H	3-Cl	4-Cl	[149-151]
1-50	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	O	H	4-CF <sub>3</sub>	4-Cl	[168-170]
1-51	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	O	H	4-CF <sub>3</sub>	4-Br	[188-190]
1-52	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	O	H	4-Cl	4-Br	[168-170]
1-53	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	O	H	3-Cl	4-Cl	[137-139]
1-54	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	O	H	3-Cl	4-Br	[128-130]
1-55	CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>	H	4-CF <sub>3</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>	[202-203]
1-56	CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>	H	3-Cl	4-Cl	[151-153]
1-57	CF <sub>3</sub>	H	H	C=O	H	3-Cl	4-Cl	[204-205]

[0116]

[表104]



第 1 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(E)	Y	Z	Y	物性値 mp. °C
1-58	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	3-Cl	H	[157-159]
1-59	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	3,4-Cl <sub>2</sub>	4-Cl	[153-155]
1-60	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	4-CF <sub>3</sub>	4-Cl	[162-164]
1-61	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	4-CF <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>	[162-164]
1-62	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	0	CH	4-CF <sub>3</sub>	4-Cl	[126-128]
1-63	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	0	CH	4-CF <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>	[112-114]
1-64	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	0	H	4-CH <sub>3</sub>	4-Cl	[110-112]
1-65	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	4-CH <sub>3</sub>	4-Cl	[200-202]
1-66	CF <sub>3</sub>	H	OCCH <sub>3</sub>	0	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	4-Cl	[58-60]
1-67	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	2-Ph	4-Cl	[173-174]
1-68	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	3-Cl	4-NO <sub>2</sub>	
1-69	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	3-cPr	4-Cl	
1-70	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	4-OCOCH <sub>3</sub>	4-Cl	
1-71	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	4-OCOCH <sub>3</sub>	4-Br	
1-72	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	4-Cl	4-SBu	
1-73	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	3-Cl	4-OH	
1-74	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	3-Cl	4-OBu	
1-75	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	4-CF <sub>3</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>	
1-76	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	2-CONMe <sub>2</sub>	4-Br	
1-77	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	3-Cl	4-OCF <sub>3</sub>	

[0117]

[表105]

第 1 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(R) <sup>4</sup>	O	1	2	物性値 mp, °C
1-78	CF <sub>3</sub>	H	H	結合	H	4-CF <sub>3</sub>	4-Cl-Ph	[206-207]
1-79	CF <sub>3</sub>	H	H	結合	H	4-CF <sub>3</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	[220]
1-80	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	結合	H	4-CF <sub>3</sub>	4-Cl-Ph	[176-181]
1-81	CF <sub>3</sub>	H	H	結合	H	4-CF <sub>3</sub>	- (n=0)	
1-82	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	CH	3,4-Cl <sub>2</sub>	Ph	NMR-2
1-83	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	CH	3,4-Cl <sub>2</sub>	4-Cl	NMR-3
1-84	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	結合	CH	4-CF <sub>3</sub>	-	
1-85	CH <sub>3</sub>	H	H	O	H	4-CH <sub>3</sub>	4-Cl	
1-86	Br	H	H	O	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	4-Cl	
1-87	OCF <sub>3</sub>	H	H	O	H	2-Cl	4-Cl	
1-88	OCN <sub>3</sub>	H	H	O	H	2-Cl	4-Cl	
1-89	NO <sub>2</sub>	H	H	O	H	3-Br	4-Cl	
1-90	CH <sub>3</sub>	H	H	O	H	4-CH <sub>3</sub>	4-Cl	
1-91	H	H	H	O	H	4-Cl	4-Br	
1-92	CH <sub>3</sub>	H	H	O	CH	4-CH <sub>3</sub>	4-Cl	
1-93	Br	H	H	O	CH	3,4-Cl <sub>2</sub>	4-Cl	
1-94	OCF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	2-Cl	4-Cl	
1-95	OCN <sub>3</sub>	H	H	O	CH	2-Cl	4-Cl	
1-96	NO <sub>2</sub>	H	H	O	CH	3-Br	4-Cl	
1-97	OPh	H	H	O	CH	4-Cl	4-Cl	
1-98	4-Cl-Ph	H	H	O	H	4-Cl	4-Cl	
1-100	4-Cl-Ph	H	H	O	CH	4-Cl	4-Cl	

〈注〉結合とは、p=0を表す（以下の表にて同じ。）

[0118]

[表106]

第 1 表 (続き)

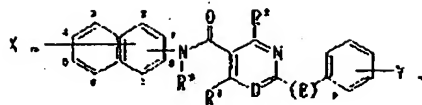
化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(B), D	X	Y	物性値 mp. °C
1-101	CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	3-Cl	H
1-102	CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	3,4-Cl <sub>2</sub>	4-Cl
1-103	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	2-OCF <sub>3</sub>	3-NO <sub>2</sub>
1-104	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-CF <sub>3</sub>	4-NO <sub>2</sub>
1-105	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	CH	4-CF <sub>3</sub>	4-SCF <sub>3</sub>
1-106	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	CH	4-CF <sub>3</sub>	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
1-107	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	N	4-CF <sub>3</sub>	4-cPr
1-108	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-CH <sub>3</sub>	4-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1-109	CF <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	O	N	3,4-Cl <sub>2</sub>	2-CH <sub>3</sub>
1-110	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	3,4-Cl <sub>2</sub>	2-CH <sub>3</sub>
1-111	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-SO <sub>2</sub> Bu <sup>*</sup>	4-Cl
1-106	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	4-SO <sub>2</sub> Bu <sup>*</sup>	4-Cl
1-107	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-OCN <sub>2</sub>	4-Cl
1-108	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	4-OCN <sub>2</sub>	4-Cl
1-111	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	4-cHex	4-SBu <sup>*</sup>
1-112	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	4-cHex	4-SBu <sup>*</sup>
1-113	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	3-Cl	4-OBu <sup>*</sup>
1-114	OH	H	H	O	N	4-CF <sub>3</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>
1-115	OH	H	H	O	CH	4-Cl	2-CONH <sub>2</sub>
1-116	cPr	H	H	O	N	3-Cl	4-OCF <sub>3</sub>
1-117	CF <sub>3</sub>	H	cPr	O	N	3-Cl	4-OCF <sub>3</sub>

\* cPr: シクロプロピル基

[0119]

【表201】

第 2 表



化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(E)	D	Nの 結合	X	Y	物性値 mp. °C
2-1	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	-(E=O)	4-Cl	
2-2	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-Cl	2-Cl	
2-3	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	7-Cl	2-Cl	
2-4	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	7-Cl	2-Cl	
2-5	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	2-Cl	4-OCF <sub>3</sub>	
2-6	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	2-Cl	4-OCF <sub>3</sub>	
2-7	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-Cl	2-NO <sub>2</sub>	
2-8	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-Cl	2-NO <sub>2</sub>	
2-9	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	2,6-Cl <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>	
2-10	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	2,6-Cl <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>	
2-11	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-Cl	2-Me	
2-12	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-Cl	2-Me	
2-13	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-CF <sub>3</sub>	3-CH	
2-14	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-CF <sub>3</sub>	3-CH	
2-15	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	1	7-CF <sub>3</sub>	H	
2-16	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	7-CF <sub>3</sub>	H	

(注) 「Nの結合」とは、N-R<sup>3</sup>基のナフチル基に結合する位置を示す。  
(以下の表にて同じ。)

【0120】

【表202】

第 2 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(E)	D	Nの 結合	I	Y	物性値 mp. °C
2-17	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-CF <sub>3</sub>	3-OB	
2-18	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-CF <sub>3</sub>	3-OB	
2-19	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	3-Cl	4-COCH <sub>3</sub>	
2-20	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-Cl	4-COCH <sub>3</sub>	
2-21	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	2-Cl	4-Ph	
2-22	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	2-Cl	4-Ph	
2-23	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-CF <sub>3</sub>	4-OCOCH <sub>3</sub>	
2-24	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-CF <sub>3</sub>	4-OCOCH <sub>3</sub>	
2-25	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	3-Cl	4-CONMe <sub>2</sub>	
2-26	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-Cl	4-CONMe <sub>2</sub>	
2-27	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	3-Cl	4-Br	
2-28	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	3-Cl	P-3-CF <sub>3</sub>	
2-29	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	P-3-CF <sub>3</sub>	4-Br	
2-30	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	2,4-F <sub>2</sub>	4-Br	
2-31	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	2,6-Cl <sub>2</sub>	4-Br	
2-32	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	3-Cl	4-SCN <sub>2</sub>	
2-33	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	3-Cl	4-SCN <sub>2</sub>	
2-34	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	3-Cl	2-OMs	
2-35	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	3-Cl	2-OMs	

\* OMs: OSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

[0121]

39 [表203]

第 2 表 (続き)

化合物 番号	R'	R''	R'''	(E)	D	Nの 結合	X	Y	物性値 mp. °C
2-36	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	H	1	3-Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
2-37	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	CH	1	3-Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
2-38	CF <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub>	O	H	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-39	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	CH	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-40	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	H	1	2-CN	4-Cl	
2-41	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	CH	1	2-CN	4-Cl	
2-42	CF <sub>3</sub>	H	OH	O	H	1	2-OH	4-Cl	
2-43	CF <sub>3</sub>	H	OH	O	CH	1	2-OH	4-F	
2-44	CH <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Cl	
2-45	CH <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Cl	
2-46	CF <sub>3</sub> H	H	H	O	H	1	2-OCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-47	CF <sub>3</sub> H	H	H	O	CH	1	2-OCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-48	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	O	H	1	7-CF <sub>3</sub>	4-Cl	
2-49	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	O	CH	1	7-CF <sub>3</sub>	4-Cl	
2-50	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	O	H	1	2-SCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-51	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	O	CH	1	2-SCH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-52	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	O	H	1	2-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Br	
2-53	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	2-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Br	
2-54	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	2-COCH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-55	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	2-COCH <sub>3</sub>	4-Cl	

[0122]

[表204]

第 2 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(B),	D	Nの 結合	Y <sub>a</sub>	Y <sub>b</sub>	物性値 mp, °C
2-56	CF <sub>3</sub>	H	H	0	N	1	3-cPr	H	
2-57	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CB	1	3-cPr	4-Cl	
2-58	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	1	5-OCOCH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-59	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	1	5-OCOCH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-60	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	0	H	1	4-OMs	4-Cl	
2-61	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	0	CH	1	4-OMs	3,4-Cl <sub>2</sub>	
2-62	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	0	H	1	2-Ph	4-Cl	
2-63	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	1	2-Ph	4-Cl	
2-64	CF <sub>3</sub>	H	OCCH <sub>3</sub>	0	H	1	5-NO <sub>2</sub>	4-Cl	
2-65	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	1	5-NO <sub>2</sub>	4-Cl	
2-66	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	1	3-CN	4-NO <sub>2</sub>	
2-67	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	1	3-cHex	4-Cl	
2-68	CF <sub>3</sub>	H	H	0	N	1	4-COCH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-69	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	1	4-OCOCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-70	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	1	2-CONMe <sub>2</sub>	4-SBu <sup>+</sup>	
2-71	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	1	2-CONMe <sub>2</sub>	4-OH	
2-72	CF <sub>3</sub>	H	H	0	N	1	3-Cl	4-OBu <sup>+</sup>	
2-73	CF <sub>3</sub>	H	cPr	0	CH	1	4-CP <sub>3</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>	
2-74	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	1	2-CONMe <sub>2</sub>	4-Br	
2-75	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	1	3-Cl	4-OCF <sub>3</sub>	

【0123】

【表205】

第 2 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(E)	R	Nの 結合	X	Y	物性値 mp. °C
2-76	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	2	4-Cl	2-Cl	
2-77	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	4-Cl	2-Cl	
2-78	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	2	7-Cl	2-Cl	
2-79	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	7-Cl	2-Cl	
2-80	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	2	2-Cl	4-OCF <sub>3</sub>	
2-81	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	1-Cl	4-OCF <sub>3</sub>	
2-81	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	2	4-Cl	2-NO <sub>2</sub>	
2-83	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	4-Cl	2-NO <sub>2</sub>	
2-84	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	2	1,6-Cl <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>	
2-85	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	1,6-Cl <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>	
2-86	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	2	4-Cl	2-Me	
2-87	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	4-Cl	2-Me	
2-88	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	2	4-CF <sub>3</sub>	3-CN	
2-89	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	4-CF <sub>3</sub>	3-CN	
2-90	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	2	7-CF <sub>3</sub>	H	
2-91	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	7-CF <sub>3</sub>	H	

【0124】

【表206】



第 2 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(E)	D	Nの 結合	X	Y	物性値 mp. °C
2-82	CF <sub>3</sub>	H	H	0	N	2	4-CF <sub>3</sub>	3-OH	
2-93	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	4-CF <sub>3</sub>	3-OH	
2-94	CF <sub>3</sub>	H	H	0	N	2	3-Cl	4-COCH <sub>3</sub>	
2-95	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	4-Cl	4-COCH <sub>3</sub>	
2-96	CF <sub>3</sub>	H	H	0	N	2	1-Cl	4-Ph	
2-97	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	1-Cl	4-Ph	
2-98	CF <sub>3</sub>	H	H	0	N	2	4-CF <sub>3</sub>	3-COCH <sub>3</sub>	
2-99	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	4-CF <sub>3</sub>	4-COCH <sub>3</sub>	
2-100	CF <sub>3</sub>	H	H	0	N	2	3-Cl	4-COMe <sub>2</sub>	
2-101	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	4-Cl	4-COMe <sub>2</sub>	
2-102	CF <sub>3</sub>	H	H	0	N	2	3-Cl	4-Br	
2-103	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	3-Cl	P-3-CF <sub>3</sub>	
2-104	CF <sub>3</sub>	H	H	0	N	2	P-3-CF <sub>3</sub>	4-Br	
2-105	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	1,4-F <sub>2</sub>	4-Br	
2-106	CF <sub>3</sub>	H	H	0	N	2	1,6-Cl <sub>2</sub>	4-Br	
2-107	CF <sub>3</sub>	H	H	0	N	2	3-Cl	SCH <sub>3</sub>	
2-108	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	3-Cl	SCH <sub>3</sub>	
2-109	CF <sub>3</sub>	H	H	0	N	2	3-Cl	2-OMs	
2-110	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	3-Cl	2-OMs	

\* OMs:OSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

第 2 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(E)	D	Nの 結合	I <sub>m</sub>	I <sub>r</sub>	物性値 mp. °C
2-111	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	N	2	3-Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
2-112	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	CH	2	3-Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
2-113	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	N	2	3-Cl	4-Br-Ph	
2-114	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	CH	2	3-Cl	4-Br-Ph	
2-115	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	N	2	1-CN	4-Cl	
2-116	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	CH	2	1-CN	4-Cl	
2-117	CF <sub>3</sub>	H	OH	O	N	2	7-OH	4-Cl	
2-118	CF <sub>3</sub>	H	OH	O	CH	2	7-OH	4-F	
2-119	CH <sub>3</sub>	H	H	O	N	2	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Cl	
2-120	CH <sub>3</sub>	H	H	O	CH	2	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Cl	
2-121	CF <sub>2</sub> H	H	H	O	N	2	7-OCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-122	CF <sub>2</sub> H	H	H	O	CH	2	7-OCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-123	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	O	N	2	7-CF <sub>3</sub>	4-Cl	
2-124	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	O	CH	2	7-CF <sub>3</sub>	4-Cl	
2-125	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	O	N	2	6-SEt	4-Br	
2-126	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	O	CH	2	6-SEt	4-Cl	
2-127	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	O	N	2	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Br	
2-128	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	2	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Br	
2-129	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	2	7-COCH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-130	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	2	7-COCH <sub>3</sub>	4-Cl	

[0126]

[表208]

第 2 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(B)	D	Nの 結合	I <sub>1</sub>	I <sub>2</sub>	物性価 mp. °C
2-131	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	H	1	3-Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
2-132	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	CH	1	3-Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
2-133	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	H	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-134	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	CH	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-135	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	H	1	2-CN	4-Cl	
2-136	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	CH	1	2-CN	4-Cl	
2-137	CF <sub>3</sub>	H	OH	結合	H	1	7-OR	4-Cl	
2-138	CF <sub>3</sub>	H	OR	結合	CH	1	7-OR	4-F	
2-139	CH <sub>3</sub>	H	H	結合	H	1	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Cl	
2-140	CH <sub>3</sub>	H	H	結合	CH	1	5-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Cl	
2-141	CF <sub>2</sub> H	H	H	結合	H	1	7-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Br	
2-142	CF <sub>2</sub> H	H	H	結合	CH	1	7-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Br	
2-143	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	結合	H	1	7-CF <sub>3</sub>	4-Cl	
2-144	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	結合	CH	2	7-CF <sub>3</sub>	4-Cl	
2-145	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	結合	H	2	6-SCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-146	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	結合	CH	2	6-SCH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-147	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	結合	H	2	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Br	
2-148	CF <sub>3</sub>	H	H	結合	CH	2	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Br	
2-149	CF <sub>3</sub>	H	H	結合	H	2	7-COCH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-150	CF <sub>3</sub>	H	H	結合	CH	2	7-COCH <sub>3</sub>	4-Cl	

[0127]

[表209]

第 2 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(5)	D	Nの 結合	X	Y	物性値 mp. °C
2-151	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	H	1	3-Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
2-152	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	CH	1	3-Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
2-153	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	H	2	3-Cl	4-Br-Ph	
2-154	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	CH	2	3-Cl	4-Br-Ph	
2-155	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	H	2	1-CH	4-Cl	
2-156	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	CH	2	1-CH	4-Cl	
2-157	CF <sub>3</sub>	H	OH	結合	H	2	7-OH	4-Cl	
2-158	CF <sub>3</sub>	H	OH	結合	CH	2	7-OH	4-Cl	
2-159	CH <sub>3</sub>	H	H	結合	H	1	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Cl	
2-160	CH <sub>3</sub>	H	H	結合	CH	1	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Cl	
2-161	CF <sub>3</sub> H	H	H	結合	H	2	7-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Br	
2-162	CF <sub>3</sub> H	H	H	結合	CH	2	7-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Br	
2-163	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	結合	H	2	7-CF <sub>3</sub>	4-Cl	
2-164	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	結合	CH	2	7-CF <sub>3</sub>	4-Cl	
2-165	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	結合	H	2	6-SCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-166	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	結合	CH	2	6-SCH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-167	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	結合	H	2	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Br	
2-168	CF <sub>3</sub>	H	H	結合	CH	2	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Br	
2-169	CF <sub>3</sub>	H	H	結合	H	1	7-COCH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-170	CF <sub>3</sub>	H	H	結合	CH	1	7-COCH <sub>3</sub>	4-Cl	

[0128]

【表210】

第 2 表 (続き)

化合物 番号	R'	R''	R'''	(B)	D	Nの 結合	T <sub>1</sub>	T <sub>2</sub>	物性値 mp. °C
2-171	CP <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	3-Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
2-172	CP <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH	1	3-Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
2-173	CP <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-174	CP <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-175	CP <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	2-CN	4-Cl	
2-176	CP <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH	1	2-CN	4-Cl	
2-177	CP <sub>3</sub>	H	OH	CH <sub>3</sub>	H	1	7-OH	4-Cl	
2-178	CP <sub>3</sub>	H	OH	CH <sub>3</sub>	CH	1	7-OH	4-F	
2-179	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	2	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Cl	
2-180	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH	2	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Cl	
2-181	CP <sub>2</sub> H	H	H	CH <sub>3</sub>	H	2	7-OCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-182	CF <sub>2</sub> H	H	H	CH <sub>3</sub>	CH	2	7-OCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-183	CP <sub>2</sub> Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	H	2	7-CF <sub>3</sub>	4-Cl	
2-184	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	CH	2	7-CF <sub>3</sub>	4-Cl	
2-185	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	H	2	6-SCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-186	CP <sub>2</sub> Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	CH	2	6-SCH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-187	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	H	2	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Br	
2-188	CP <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH	2	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Br	
2-189	CP <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	2	7-COCH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-190	CP <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH	2	7-COCH <sub>3</sub>	4-Cl	

[0129]

[表211]

第 2 表 (続き)

化合物 番号	R'	R''	R'''	(E)	D	Nの 結合	X	Y	物性値 mp. °C
2-191	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	3-Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
2-192	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	1	3-Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
2-193	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-194	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-195	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	2	1-CH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-196	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2	1-CH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-197	CF <sub>3</sub>	H	OH	CH <sub>3</sub>	H	1	7-OH	4-Cl	
2-198	CF <sub>3</sub>	H	OH	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	7-OH	4-F	
2-199	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	1	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Cl	
2-200	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Cl	
2-201	CF <sub>3</sub> H	H	H	CH <sub>3</sub>	H	2	7-OCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-202	CF <sub>3</sub> H	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2	7-OCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-203	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	H	1	7-CF <sub>3</sub>	4-Cl	
2-204	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	7-CF <sub>3</sub>	4-Cl	
2-205	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	H	1	6-SCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-206	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	6-SCH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-207	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	H	2	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Br	
2-208	CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Br	
2-209	CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	1	7-COCH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-210	CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1	7-COCH <sub>3</sub>	4-Cl	

[0130]

[表212]

第 2 表 (続き)

化合物 番号	R'	R''	R'''	(E)	D	Nの 結合	Y <sub>1</sub>	Y <sub>2</sub>	物性値 mp. °C
2-211	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	H	2	3-Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
2-212	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	CH	2	3-Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
2-213	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	H	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-214	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	CH	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-215	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	H	2	1-CH	4-Cl	
2-216	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	CH	2	1-CH	4-Cl	
2-217	CF <sub>3</sub>	H	OH	CO	H	1	7-OH	4-Cl	
2-218	CF <sub>3</sub>	H	OH	CO	CH	1	7-OH	4-F	
2-219	CH <sub>3</sub>	H	H	CO	H	2	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Cl	
2-220	CH <sub>3</sub>	H	H	CO	CH	2	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Cl	
2-221	CF <sub>3</sub> H	H	H	CO	H	2	7-OCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-222	CF <sub>3</sub> H	H	H	CO	CH	2	7-OCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-223	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CO	H	2	7-CF <sub>3</sub>	4-Cl	
2-224	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CO	CH	2	7-CF <sub>3</sub>	4-Cl	
2-225	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CO	H	2	6-SCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-226	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CO	CH	2	6-SCH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-227	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CO	H	2	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Br	
2-228	CF <sub>3</sub>	H	H	CO	CH	2	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Br	
2-229	CF <sub>3</sub>	H	H	CO	H	1	7-COCH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-230	CF <sub>3</sub>	H	H	CO	CH	1	7-COCH <sub>3</sub>	4-Cl	

[0131]

[表213]

第 2 表 (続き)

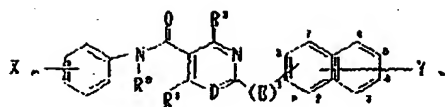
化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(R) <sub>4</sub>	D	Nの 結合	X	Y	物性値 mp. °C
2-231	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	H	1	3-Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
2-232	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	CH	1	3-Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
2-233	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	H	2	3-Cl	4-Br-Ph	
2-234	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	CH	2	3-Cl	4-Br-Ph	
2-235	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	H	2	1-CH	4-Cl	
2-236	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	CH	2	1-CH	4-Cl	
2-237	CF <sub>3</sub>	H	OH	CO	H	1	7-OH	4-Cl	
2-238	CF <sub>3</sub>	H	OH	CO	CH	1	7-OH	4-Cl	
2-239	CH <sub>3</sub>	H	H	CO	H	2	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Cl	
2-240	CH <sub>3</sub>	H	H	CO	CH	2	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Cl	
2-241	CF <sub>2</sub> H	H	H	CO	H	1	7-OCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-242	CF <sub>2</sub> H	H	H	CO	CH	1	7-OCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-243	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CO	H	2	7-CP <sub>2</sub>	4-Cl	
2-244	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CO	CH	2	7-CP <sub>2</sub>	4-Cl	
2-245	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CO	H	2	6-SCH <sub>3</sub>	4-Br	
2-246	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CO	CH	2	6-SCH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-247	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CO	H	1	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Br	
2-248	CF <sub>3</sub>	H	H	CO	CH	1	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Br	
2-249	CF <sub>3</sub>	H	H	CO	H	1	7-COCH <sub>3</sub>	4-Cl	
2-250	CF <sub>3</sub>	H	H	CO	CH	1	7-COCH <sub>3</sub>	4-Cl	

[0132]

[表301]



## 第 3 表



化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(B)	D	結合 位置	Y <sub>1</sub>	Y <sub>2</sub>	物性値 mp. °C
3-1	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	2-Cl	4-Cl	
3-2	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	2-Cl	4-Cl	
3-3	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	2-Cl	7-Cl	
3-4	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	2-Cl	7-Cl	
3-5	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-OCF <sub>3</sub>	2-Cl	
3-6	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-OCF <sub>3</sub>	2-Cl	
3-7	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	2-NO <sub>2</sub>	4-Cl	
3-8	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	2-NO <sub>2</sub>	4-Cl	
3-9	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-CF <sub>3</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>	
3-10	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-CF <sub>3</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>	
3-11	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	2-Me	4-Cl	
3-12	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	2-Me	4-Cl	
3-13	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	3-CN	4-CF <sub>3</sub>	
3-14	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	3-CN	4-CF <sub>3</sub>	
3-15	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	H	7-CF <sub>3</sub>	
3-16	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	H	7-CF <sub>3</sub>	

[0133]

[表302]

第 3 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(B)	D	Nの 割合	I <sub>1</sub>	I <sub>2</sub>	物性値 mp. °C
3-17	CF <sub>3</sub>	H	H	O	R	1	3-OH	4-CF <sub>3</sub>	
3-18	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	3-OH	4-CF <sub>3</sub>	
3-19	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-COCH <sub>3</sub>	3-Cl	
3-20	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-COCH <sub>3</sub>	4-Cl	
3-21	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-Ph	2-Cl	
3-22	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-Ph	2-Cl	
3-23	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-OCOCH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub>	
3-24	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-OCOCH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub>	
3-25	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-COMe <sub>2</sub>	3-Cl	
3-26	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-COMe <sub>2</sub>	4-Cl	
3-27	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-Br	3-Cl	
3-28	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	6-3-CF <sub>3</sub>	3-Cl	
3-29	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-Br	2-F-3-CF <sub>3</sub>	
3-30	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-Br	2,4-F <sub>2</sub>	
3-31	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-Br	2,6-Cl <sub>2</sub>	
3-32	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	SCN <sub>2</sub>	3-Cl	
3-33	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	SCN <sub>2</sub>	3-Cl	
3-34	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	2-OMs	3-Cl	
3-35	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	2-OMs	3-Cl	

(注) OMs:OSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> を表す。

表 3 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(B),	D	Nの 結合	I <sub>1</sub>	I <sub>2</sub>	物性値 mp: °C
3-36	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	H	1	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Cl	
3-37	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	CH	1	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Cl	
3-38	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	H	1	4-Br-Ph	3-Cl	
3-39	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	CH	1	4-Br-Ph	3-Cl	
3-40	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	H	1	4-Cl	2-CH <sub>3</sub>	
3-41	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	CH	1	4-Cl	2-CH <sub>3</sub>	
3-42	CF <sub>3</sub>	H	OH	O	H	1	4-Cl	2-OH	
3-43	CF <sub>3</sub>	H	OH	O	CH	1	4-F	2-OH	
3-44	CH <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	2-Cl	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
3-45	CH <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	2-Cl	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
3-46	CF <sub>3</sub> H	H	H	O	N	1	4-Br	2-OCH <sub>3</sub>	
3-47	CF <sub>3</sub> H	H	H	O	CH	1	4-Br	2-OCH <sub>3</sub>	
3-48	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	O	N	1	4-Cl	7-CF <sub>3</sub>	
3-49	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	O	CH	1	4-Cl	7-CF <sub>3</sub>	
3-50	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	O	N	1	4-Br	2-SCH <sub>3</sub>	
3-51	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	O	CH	1	4-Cl	2-SCH <sub>3</sub>	
3-52	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	O	H	1	4-Br	2-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
3-53	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-Br	2-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
3-54	CF <sub>3</sub>	H	H	O	N	1	4-Cl	2-COCH <sub>3</sub>	
3-55	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-Cl	2-COCH <sub>3</sub>	

[0135]

[表304]

第 3 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(E)	D	Nの 結合	I	Y	特性値 mp. °C
3-56	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	H	3-cPr	
3-57	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-Cl	3-cPr	
3-58	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-Cl	5-OCOCH <sub>3</sub>	
3-59	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-Cl	5-OCOCH <sub>3</sub>	
3-60	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	H	1	4-Cl	4-ONs	
3-61	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	CH	1	3,4-Cl <sub>2</sub>	4-ONs	
3-62	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	O	H	1	4-Cl	2-Ph	
3-63	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-Cl	2-Ph	
3-64	CF <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	O	H	1	4-Cl	5-NO <sub>2</sub>	
3-65	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-Cl	5-NO <sub>2</sub>	
3-66	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-NO <sub>2</sub>	3-CN	
3-67	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-Cl	3-cHex	
3-68	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-Cl	4-COCH <sub>3</sub>	
3-69	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-Br	4-OCOCH <sub>3</sub>	
3-70	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-SBu <sup>1</sup>	2-CONMe <sub>2</sub>	
3-71	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-ONs	2-CONMe <sub>2</sub>	
3-72	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-OBu <sup>1</sup>	3-Cl	
3-73	CF <sub>3</sub>	H	cPr	O	CH	1	2,6-Cl <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>	
3-74	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	1	4-Br	2-CONMe <sub>2</sub>	
3-75	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	1	4-OCF <sub>3</sub>	3-Cl	

[0136]

[表305]

第 3 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(E)	D	Nの 結合	Y <sub>1</sub>	Y <sub>2</sub>	物性値 mp. °C
3-76	CP <sub>3</sub>	H	H	0	H	2	2-Cl	4-Cl	
3-77	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	2-Cl	4-Cl	
3-78	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	2	2-Cl	7-Cl	
3-79	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	2-Cl	7-Cl	
3-76	CP <sub>3</sub>	H	H	0	H	2	4-OCF <sub>3</sub>	2-Cl	
3-77	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	4-OCF <sub>3</sub>	1-Cl	
3-78	CP <sub>3</sub>	H	H	0	H	2	2-HO <sub>2</sub>	4-Cl	
3-79	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	2-HO <sub>2</sub>	4-Cl	
3-76	CP <sub>3</sub>	H	H	0	H	2	4-CF <sub>3</sub>	1,6-Cl <sub>2</sub>	
3-77	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	4-CF <sub>3</sub>	1,6-Cl <sub>2</sub>	
3-78	CP <sub>3</sub>	H	H	0	H	2	2-Me	4-Cl	
3-79	CP <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	2-Me	4-Cl	
3-76	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	2	3-CN	4-CP <sub>3</sub>	
3-77	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	3-CN	4-CP <sub>3</sub>	
3-78	CP <sub>3</sub>	H	H	0	H	2	H	7-CP <sub>3</sub>	
3-79	CP <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	H	7-CP <sub>3</sub>	

[0137]

[表306]

表 3 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(E)	D	Nの 結合	X	Y	物性値 mp. °C
3-92	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	2	3-OH	4-CF <sub>3</sub>	
3-93	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	2	3-OH	4-CF <sub>3</sub>	
3-94	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	2	4-COCH <sub>3</sub>	3-Cl	
3-95	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	2	4-COCH <sub>3</sub>	4-Cl	
3-96	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	2	4-Ph	1-Cl	
3-97	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	2	4-Ph	1-Cl	
3-98	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	2	4-OCOCCH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub>	
3-99	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	2	4-OCOCCH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub>	
3-100	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	2	4-CONHMe <sub>2</sub>	3-Cl	
3-101	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	2	4-CONHMe <sub>2</sub>	4-Cl	
3-102	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	2	4-Br	3-Cl	
3-103	CF <sub>3</sub>	H	O	O	CH	2	P-3-CF <sub>3</sub>	3-Cl	
3-104	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	2	4-Br	P-3-CF <sub>3</sub>	
3-105	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	2	4-Br	1,4-Ph <sub>2</sub>	
3-106	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	2	4-Br	1,6-Cl <sub>2</sub>	
3-107	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	2	SCN <sub>2</sub>	3-Cl	
3-108	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	2	SCN <sub>2</sub>	3-Cl	
3-109	CF <sub>3</sub>	H	H	O	H	2	Cl-2-OMs	3-Cl	
3-110	CF <sub>3</sub>	H	H	O	CH	2	Cl-2-OMs	3-Cl	

\* OMs:OSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

第 3 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(R) <sub>4</sub>	D	Nの 結合	I <sub>1</sub>	I <sub>2</sub>	物性値 mp. °C
3-111	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	0	H	2	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Cl	
3-112	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	0	CH	2	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Cl	
3-113	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	0	H	2	4-Br-Ph	3-Cl	
3-114	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	0	CH	2	4-Br-Ph	3-Cl	
3-115	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	0	H	2	4-Cl	1-CN	
3-116	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	0	CH	2	4-Cl	1-CN	
3-117	CF <sub>3</sub>	H	OH	0	H	2	4-Cl	7-OH	
3-118	CF <sub>3</sub>	H	OH	0	CH	2	4-P	7-OH	
3-119	CH <sub>3</sub>	H	H	0	H	2	2-Cl	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
3-120	CH <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	2-Cl	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
3-121	CF <sub>3</sub> H	H	H	0	H	2	4-Br	7-OCH <sub>3</sub>	
3-122	CF <sub>3</sub> H	H	H	0	CH	2	4-Br	7-OCH <sub>3</sub>	
3-123	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	0	H	2	4-Cl	7-CF <sub>3</sub>	
3-124	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	0	CH	2	4-Cl	7-CF <sub>3</sub>	
3-125	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	0	H	2	4-Br	6-SCH <sub>3</sub>	
3-126	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	0	CH	2	4-Cl	6-SCH <sub>3</sub>	
3-127	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	0	H	2	4-Br	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
3-128	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	4-Br	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
3-129	CF <sub>3</sub>	H	H	0	H	2	4-Cl	7-COCH <sub>3</sub>	
3-130	CF <sub>3</sub>	H	H	0	CH	2	4-Cl	7-COCH <sub>3</sub>	

[0139]

[表308]

第 3 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(E)	D	Nの 結合	X <sub>1</sub>	Y <sub>1</sub>	物性値 mp. °C
3-131	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	H	1	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Cl	
3-132	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	CH	1	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Cl	
3-133	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	H	1	4-Br-Ph	3-Cl	
3-134	CF <sub>3</sub>	H	H	結合	CH	1	4-CF <sub>3</sub>	-	[190-191]
3-135	CF <sub>3</sub>	H	H	結合	H	1	4-CF <sub>3</sub>	-	
3-136	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	CH	1	4-Cl	2-CH	
3-137	CF <sub>3</sub>	H	OH	結合	H	1	4-Cl	7-OH	
3-138	CF <sub>3</sub>	H	OH	結合	CH	1	4-F	7-OH	
3-139	CH <sub>3</sub>	H	H	結合	H	1	2-Cl	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
3-140	CH <sub>3</sub>	H	H	結合	CH	1	2-Cl	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
3-141	CF <sub>2</sub> H	H	H	結合	H	1	4-Br	7-OCH <sub>3</sub>	
3-142	CF <sub>2</sub> H	H	H	結合	CH	1	4-Br	7-OCH <sub>3</sub>	
3-143	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	結合	H	1	4-Cl	7-CF <sub>3</sub>	
3-144	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	結合	CH	2	4-Cl	7-CF <sub>3</sub>	
3-145	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	結合	H	2	4-Br	6-SCH <sub>3</sub>	
3-146	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	結合	CH	2	4-Cl	6-SCH <sub>3</sub>	
3-147	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	結合	H	2	4-Br	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
3-148	CF <sub>3</sub>	H	H	結合	CH	2	4-Br	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
3-149	CF <sub>3</sub>	H	H	結合	H	2	4-Cl	7-COCH <sub>3</sub>	
3-150	CF <sub>3</sub>	H	H	結合	CH	2	4-Cl	7-COCH <sub>3</sub>	

[0140]

[表309]



第 3 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(E)	D	Nの 結合	I <sub>1</sub>	I <sub>2</sub>	物性値 mp. °C
3-151	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	H	1	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Cl	
3-152	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	CH	1	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Cl	
3-153	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	H	2	4-Br-Pb	3-Cl	
3-154	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	CH	2	4-Br-Pb	3-Cl	
3-155	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	H	2	4-Cl	1-CH	
3-156	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	結合	CH	2	4-Cl	1-CH	
3-157	CF <sub>3</sub>	H	OH	結合	H	2	4-Cl	7-OH	
3-158	CF <sub>3</sub>	H	OH	結合	CH	2	4-F	7-OH	
3-159	CH <sub>3</sub>	H	H	結合	H	1	2-Cl	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
3-160	CH <sub>3</sub>	H	H	結合	CH	1	2-Cl	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
3-161	CF <sub>3</sub> H	H	H	結合	H	2	4-Br	7-OCH <sub>3</sub>	
3-162	CF <sub>3</sub> H	H	H	結合	CH	2	4-Br	7-OCH <sub>3</sub>	
3-163	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	結合	H	2	4-Cl	7-CF <sub>3</sub>	
3-164	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	結合	CH	2	4-Cl	7-CF <sub>3</sub>	
3-165	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	結合	H	2	4-Br	6-SCH <sub>3</sub>	
3-166	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	結合	CH	2	4-Cl	6-SCH <sub>3</sub>	
3-167	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	結合	H	2	4-Br	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
3-168	CF <sub>3</sub>	H	H	結合	CH	2	4-Br	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
3-169	CF <sub>3</sub>	H	H	結合	H	1	4-Cl	7-COCH <sub>3</sub>	
3-170	CF <sub>3</sub>	H	H	結合	CH	1	4-Cl	7-COCH <sub>3</sub>	

[0141]

[表310]

第 3 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(E)	D	Nの 結合	X <sub>1</sub>	Y <sub>1</sub>	物性値 mp. °C
3-171	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	H	1	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Cl	
3-172	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH	1	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Cl	
3-173	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Br-Ph	3-Cl	
3-174	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH	1	4-Br-Ph	3-Cl	
3-175	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	H	1	4-Cl	2-CN	
3-176	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH	1	4-Cl	2-CN	
3-177	CF <sub>3</sub>	H	OH	CH <sub>2</sub>	H	1	4-Cl	7-OH	
3-178	CF <sub>3</sub>	H	OH	CH <sub>2</sub>	CH	1	4-F	7-OH	
3-179	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>	H	2	2-Cl	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
3-180	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>	CH	2	2-Cl	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
3-181	CF <sub>3</sub> H	H	H	CH <sub>2</sub>	H	2	4-Br	7-OCN <sub>2</sub>	
3-182	CF <sub>3</sub> H	H	H	CH <sub>2</sub>	CH	2	4-Br	7-OCN <sub>2</sub>	
3-183	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CH <sub>2</sub>	H	2	4-Cl	7-CF <sub>3</sub>	
3-184	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CH <sub>2</sub>	CH	2	4-Cl	7-CF <sub>3</sub>	
3-185	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CH <sub>2</sub>	H	2	4-Br	6-SCN <sub>2</sub>	
3-186	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CH <sub>2</sub>	CH	2	4-Cl	6-SCN <sub>2</sub>	
3-187	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CH <sub>2</sub>	H	2	4-Br	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
3-188	CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>	CH	2	4-Br	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
3-189	CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>	H	2	4-Cl	7-COCH <sub>3</sub>	
3-190	CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub>	CH	2	4-Cl	7-COCH <sub>3</sub>	

[0142]

[表311]

表 3 (続々)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(Z)	D	Nの 結合	I <sub>1</sub>	I <sub>2</sub>	物性値 mp. °C
3-181	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Cl	
3-182	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH	1	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Cl	
3-193	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Br-Ph	3-Cl	
3-194	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH	1	4-Br-Ph	3-Cl	
3-195	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	2	4-Cl	1-CH <sub>3</sub>	
3-196	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH	2	4-Cl	1-CH <sub>3</sub>	
3-197	CF <sub>3</sub>	H	OH	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Cl	7-OH	
3-198	CF <sub>3</sub>	H	OH	CH <sub>3</sub>	CH	1	4-F	7-OH	
3-199	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	1	2-Cl	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
3-200	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH	1	2-Cl	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
3-201	CF <sub>3</sub> H	H	H	CH <sub>3</sub>	H	2	4-Br	7-OCN <sub>3</sub>	
3-202	CF <sub>3</sub> H	H	H	CH <sub>3</sub>	CH	2	4-Br	7-OCN <sub>3</sub>	
3-203	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Cl	7-CF <sub>3</sub>	
3-204	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	CH	1	4-Cl	7-CF <sub>3</sub>	
3-205	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Br	6-SCN <sub>3</sub>	
3-206	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	CH	1	4-Cl	6-SCN <sub>3</sub>	
3-207	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	H	2	4-Br	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
3-208	CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH	2	4-Br	7-SO <sub>2</sub> Cl <sub>2</sub>	
3-209	CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	1	4-Cl	7-COCH <sub>3</sub>	
3-210	CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH	1	4-Cl	7-COCH <sub>3</sub>	

[0143]

【表312】

第 3 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(E)	D	Nの 結合	X	Y	物性値 mp. °C
3-211	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	H	2	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Cl	
3-212	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	CH	2	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Cl	
3-213	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	H	1	4-Br-Ph	3-Cl	
3-214	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	CH	1	4-Br-Ph	3-Cl	
3-215	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	H	2	4-Cl	1-CH	
3-216	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	CH	2	4-Cl	1-CH	
3-217	CF <sub>3</sub>	H	OH	CO	H	1	4-Cl	7-OH	
3-218	CF <sub>3</sub>	H	OH	CO	CH	1	4-F	7-OH	
3-219	CH <sub>3</sub>	H	H	CO	H	2	2-Cl	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
3-220	CH <sub>3</sub>	H	H	CO	CH	2	2-Cl	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
3-221	CF <sub>3</sub> H	H	H	CO	H	2	4-Br	7-OCN <sub>2</sub>	
3-222	CF <sub>3</sub> H	H	H	CO	CH	2	4-Br	7-OCN <sub>2</sub>	
3-223	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	CO	H	2	4-Cl	7-CF <sub>3</sub>	
3-224	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	CO	CH	2	4-Cl	7-CF <sub>3</sub>	
3-225	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	CO	H	2	4-Br	6-SCH <sub>3</sub>	
3-226	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	CO	CH	2	4-Cl	6-SCH <sub>3</sub>	
3-227	CF <sub>3</sub> Cl	H	H	CO	H	2	4-Br	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
3-228	CF <sub>3</sub>	H	H	CO	CH	2	4-Br	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
3-229	CF <sub>3</sub>	H	H	CO	H	1	4-Cl	7-COCH <sub>3</sub>	
3-230	CF <sub>3</sub>	H	H	CO	CH	1	4-Cl	7-COCH <sub>3</sub>	

[0144]

[表313]

第 3 表 (続き)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(E)	D	Nの 結合	X	Y	物性値 mp. °C
3-231	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	H	1	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Cl	
3-232	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	CH	1	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Cl	
3-233	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	H	2	4-Br-Ph	3-Cl	
3-234	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	CH	2	4-Br-Ph	3-Cl	
3-235	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	H	2	4-Cl	1-CN	
3-236	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO	CH	2	4-Cl	1-CN	
3-237	CF <sub>3</sub>	H	OH	CO	H	1	4-Cl	7-OH	
3-238	CF <sub>3</sub>	H	OH	CO	CH	1	4-F	7-OH	
3-239	CH <sub>3</sub>	H	H	CO	H	2	2-Cl	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
3-240	CH <sub>3</sub>	H	H	CO	CH	2	2-Cl	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
3-241	CF <sub>2</sub> H	H	H	CO	H	1	4-Br	7-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
3-242	CF <sub>2</sub> H	H	H	CO	CH	1	4-Br	7-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
3-243	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CO	H	2	4-Cl	7-CF <sub>3</sub>	
3-244	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CO	CH	2	4-Cl	7-CF <sub>3</sub>	
3-245	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CO	H	2	4-Br	6-SCH <sub>3</sub>	
3-246	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CO	CH	2	4-Cl	6-SCH <sub>3</sub>	
3-247	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	CO	H	1	4-Br	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
3-248	CF <sub>3</sub>	H	H	CO	CH	1	4-Br	7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
3-249	CF <sub>3</sub>	H	H	CO	H	1	4-Cl	7-COCH <sub>3</sub>	
3-250	CF <sub>3</sub>	H	H	CO	CH	1	4-Cl	7-COCH <sub>3</sub>	

【0145】

\* \* 【表401】

第 4 表

化合物番号	<sup>1</sup> H-NMRデータ (CDCl <sub>3</sub> , TMS, δ ppm)
1 - 42	3.50(3H, s), 6.98(1H, m), 7.07(2H, d), 7.11(1H, s), 7.22(2H, d), 7.37(2H, d), 8.40(1H, s)
1 - 82	3.50(3H, s), 6.95(1H, d), 7.28-7.35(2H, m), 7.40-7.69(3H, m), 7.96(1H, s), 8.06(2H, m), 8.50(1H, s)
1 - 83	3.50(3H, s), 6.95(1H, d), 7.28-7.35(2H, m), 7.45(2H, d), 7.85(1H, s), 7.95(2H, d), 8.50(1H, s)

【0146】(農薬用殺虫剤)次に、本発明の組成物の実施例を若干示すが、添加物及び添加割合は、これら実施例に限定されるべきものではなく、広範囲に変化さ

※せることが可能である。以下の製剤実施例中の部は重量部を表す。

【0147】

## 実施例5 水和剤

本発明化合物	40部
珪藻土	53部
高級アルコール硫酸エステル	4部
アルキルナフタレンスルホン酸塩	3部

以上を均一に混合して微細に粉砕することにより、有効成分40%の水和剤を得る。 \* 【0148】

## 実施例6 乳剤

本発明化合物	30部
キシレン	33部
ジメチルホルムアミド	30部
ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル	7部

以上を混合溶解することにより、有効成分30%の乳剤 \* 【0149】  
を得る。 ※

## 実施例7 粉剤

本発明化合物	10部
タルク	89部
ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル	1部

以上を均一に混合して微細に粉砕することにより、有効成分10%の粉剤を得る。 ★ 【0150】

## 実施例8 粒剤

本発明化合物	5部
クレー	73部
ベントナイト	20部
ジオクチルスルホサキシネートナトリウム塩	1部
リン酸ナトリウム	1部

以上を粉砕混合し、水を加えてよく練り合せた後、造粒 ☆ 【0151】  
乾燥して有効成分5%の粒剤を得る。 ☆

## 実施例9 懸濁剤

本発明化合物	10部
リグニンスルホン酸ナトリウム	4部
ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム	1部
キサントガム	0.2部
水	84.8部

以上を混合し、粒度が1ミクロン以下になるまで湿式粉 30◆のクロルジメホルムの殺虫率は40%であった。

砕することにより、有効成分10%の懸濁剤を得る。

## 【0152】

【発明の効果】 (試験例-殺虫・殺ダニ剤)

## 試験例1 アワヨトウに対する効力試験

前記の薬剤の実施例5に示された水和剤の処方に従い、化合物濃度が125ppmになるように水で希釈した。その葉液中にトウモロコシ葉を30秒間浸漬し、乾燥後、アワヨトウ2令幼虫が5頭入っているシャーレにその葉を入れた。ガラス蓋をして、温度25℃、湿度65%の恒温室内に置き、5日後に殺虫率を調べた。試験は2反復で行った。対照化合物として、クロルジメホルム(125ppm)を用いた。その結果、以下の化合物が80%以上の優れた殺虫率を示した。一方、対照化合物◆

【0153】化合物番号：1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-10, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-23, 1-24, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-33, 1-34, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-56, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-65, 1-66, 1-67, 2-1, 2-2, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6

フロントページの続き

(51)Int.Cl.

A01N 43/40  
43/54

識別記号

101

Fi

A01N 43/40  
43/54

フィード(参考)

101D  
B

(47)

特開2000-226372

C

C07D 239/28  
239/34

C07D 239/28  
239/34

(72)発明者 岩佐 孝男  
神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式  
会社小田原研究所内  
(72)発明者 武 智広  
神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式  
会社小田原研究所内  
(72)発明者 高橋 英光  
神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式  
会社小田原研究所内

Fターム(参考) 4C055 AA01 BA02 BA06 BA08 BA13  
BA18 BA21 BA42 BB02 BB04  
BB07 BB08 BB09 BB11 CA02  
CA18 DA01 DA06 DA13 DA39  
DA42 DA51 DA59 DB02 DB04  
DB07  
4H011 AC02 AC04 BB09 DA02 DA13  
DA15 DA16